

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2003 年 1 月 3 日 (03.01.2003)

PCT

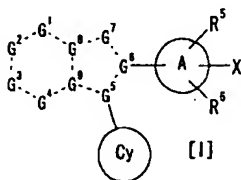
(10) 国際公開番号  
WO 03/000254 A1

- (51) 国際特許分類: A61K 31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 31/427, 31/506, 31/437, C07D 235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P 31/12, 1/16, 43/00
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒105-8422 東京都港区 虎ノ門二丁目 2 番 1 号 Tokyo (JP).
- (21) 国際出願番号: PCT/JP02/06405
- (72) 発明者; および
- (22) 国際出願日: 2002 年 6 月 26 日 (26.06.2002)
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 橋本 宏正 (HASHIMOTO, Hiromasa) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 水谷 憲二 (MIZUTANI, Kenji) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 吉田 厚仁 (YOSHIDA, Atsuhito) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP).
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願2001-193786 2001 年 6 月 26 日 (26.06.2001) JP  
特願 2001-351537  
2001 年 11 月 16 日 (16.11.2001) JP
- (74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒541-0044 大阪府大阪市 中央区伏見町四丁目 2 番 1 4 号 藤村大和生命ビル Osaka (JP).

[続葉有]

(54) Title: FUSED CYCLIC COMPOUNDS AND MEDICINAL USE THEREOF

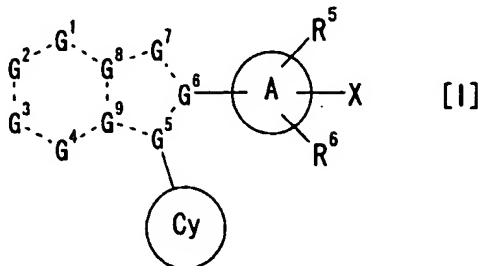
(54) 発明の名称: 縮合環化合物及びその医薬用途



(57) Abstract: Fused cyclic compounds represented by the following general formula [I] or pharmaceutically acceptable salts thereof and remedies for hepatitis C containing these compounds: [I] wherein each symbol is as defined in the description. Because of having an effect against hepatitis C virus (HCV) based on an HCV polymerase inhibitory effect, these compounds are useful as remedies or preventives for hepatitis C.

(57) 要約:

本発明は、下記一般式 [I]



(式中、各記号は明細書に記載の通りである。) 等で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及びそれら化合物を含有してなる C 型肝炎治療剤に関する。本発明の化合物は、C 型肝炎ウイルス (HCV) ポリメラーゼ阻害作用により抗 HCV 作用を示し、C 型肝炎の治療剤又は予防剤として有用である。



(81) 指定国 (国内): AE, AG, AI, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ユーロッパ特

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。



## 明細書

## 縮合環化合物及びその医薬用途

## 技術分野

本発明は、C型肝炎治療剤として有用な新規な縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩或いはそれらの合成中間体化合物に関する。また本発明は、ある種の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩のC型肝炎治療剤としての新規な用途に関する。更に詳しくは、抗C型肝炎ウイルス（HCV）作用、特にRNA依存性RNAポリメラーゼ阻害活性により抗HCV作用を示すC型肝炎の予防若しくは治療に有効な縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を含むC型肝炎治療剤に関する。

## 背景技術

1989年、輸血後の非A非B型肝炎の主要な原因ウイルスが発見されC型肝炎ウイルス（HCV）と名づけられた。現在では、A型、B型、C型の他、数種の肝炎ウイルスが発見されており、HCVにより引き起こされる肝炎がC型肝炎と呼ばれている。

HCV感染患者は全世界人口の数%にも及ぶと推定されており、その感染は長期慢性化する特徴を有する。

HCVは、エンベロープを有するRNAウイルスであり、ゲノムは一本鎖プラス鎖RNAで、フラビウイルス科のHepacivirus属に分類される（International Union of Microbiological Societies の The International Committee on Taxonomy of Viruses より）。例えば同じ肝炎ウイルスであっても、DNAウイルスであるB型肝炎ウイルス（HBV）は、免疫能の未熟な新生児、乳幼児期以外では、たとえ感染しても免疫機構により排除され急性感染で終わる。それと比較し、HCVは、未だ明らかではない原因により宿主の免疫機構を回避するため、免疫機構の発達した大人に感染した場合でも持続感染に移行することが多い。

HCVの持続感染に伴い慢性肝炎が引き起こされると、その後、高率に肝硬変、肝癌へと進行し、手術で癌を摘出しても、非癌部で引き続き起こる炎症のため肝癌が再発する患者も多いことが知られている。また、HCV感染が慢性蕁麻疹、扁平苔癬、クリオグロブリン血症性紫斑等の皮膚疾患に関与するとの報告も見ら

れる（日皮会誌，111(7)，1075-81，2001）。

よって、C型肝炎の有効な治療方法の確立が望まれており、その中でも、抗炎症剤により炎症を抑える対症療法とは別に、炎症が引き起こされない程度にHCVを減らす或はHCVを根絶させる薬剤の開発が強く望まれている。

現在、HCV排除の唯一有効な治療法としてインターフェロン治療が知られている。しかし、インターフェロンによりウイルスを排除できる人は、全患者の1/3程度であり、残りの人には全く効かない、若しくは一時的な効果しか見られないことが知られている。従って、インターフェロンに代わり用いられる若しくはそれと併用される抗HCV薬への期待は大きい。

近年、リバビリン（Ribavirin：1- $\beta$ -D-リボフラノシル-1H-1，2，4-トリアゾール-3-カルボキサミド）がインターフェロンとの併用によるC型肝炎治療剤として市販されているが、インターフェロンの有効性を高めはするものの、依然有効率は低く、更なる新規なC型肝炎治療剤が望まれている。

また、インターフェロンアゴニスト、インターロイキン-12アゴニスト等、患者自身の免疫力を増強させウイルスを排除する手段も試みられているが、未だ有効とされる薬剤は見出されていない。

また近年、HCV特異的なタンパク質をターゲットとしたHCV増殖阻害にも注目が集まっている。

HCV自身の遺伝子にはセリンプロテアーゼ、RNAヘリカーゼ、RNA依存性RNAポリメラーゼ等のタンパク質がコードされており、それらタンパク質はHCVの増殖に必須の特異的タンパク質として機能する。

特異的タンパク質の一つであるRNA依存性RNAポリメラーゼ（以後単にHCVポリメラーゼとも言う。）は、ウイルス増殖に必須の酵素である。プラス鎖RNA遺伝子を持つHCVの遺伝子複製は、まずプラス鎖RNAを鋳型にして、相補的なマイナス鎖RNAを合成し、さらにそのマイナス鎖RNAを鋳型にしてプラス鎖RNAを増幅するという手順によると考えられている。HCVのコードするタンパク質前駆体のNS5Bと呼ばれる部位が、RNA依存性RNAポリメラーゼ活性を示すことが示されており（EMBO J., 15, 12-22, 1996）、HCV遺伝子

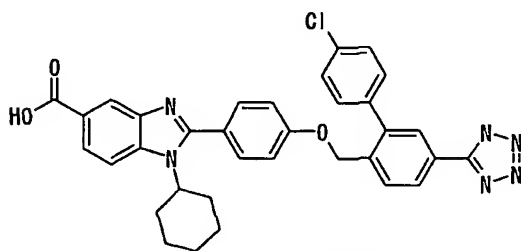
複製の中心的役割を果たすと考えられている。

よって、HCVポリメラーゼの阻害剤は、抗HCV薬開発のターゲットとなり得、その開発への期待は高い。しかし、その他の作用機序による抗HCV薬の開発と同様、未だ有効なHCVポリメラーゼ阻害剤の開発には至っておらず、未だC型肝炎を治療できる薬剤は不十分である。

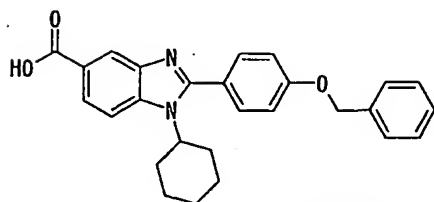
次に本発明に比較的類似の既知化合物について述べる。

ベンゾイミダゾール骨格を有するC型肝炎治療剤としては、特開2001-247550号(WO01/47883号、EP1162196A1)及びWO02/04425号が公知である。

当該公報には、インテグラーゼ阻害活性を有する抗HIV剤として、それぞれ、下記β-ケトアミド化合物J等、K等が記載されている。



化合物J



化合物K

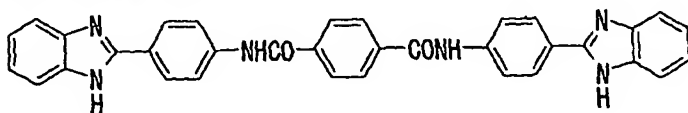
なお、当該公報の最先の公開日は、それぞれ、2001年7月5日(WO01/47883号)、2002年1月17日(WO02/04425号)であるのに対し、本出願の優先権主張日が、それ以前の2001年6月26日であることを考慮されたい。

また、ベンゾイミダゾール骨格を有するC型肝炎治療剤としては、WO97/36866号、特表2000-511899号(EP906097号)、WO99/51619号も公知である。

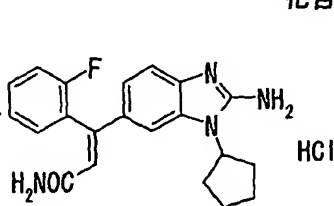
WO 97/36866号には下記化合物D等が開示されており、該化合物のHCVヘリカーゼ阻害活性について記載されている。

特表2000-511899号(EP906097号)には下記化合物E等が、また、WO99/51619号には下記化合物F等が開示されており、両者ともにHCV阻害剤として有効な可能性が述べられている。

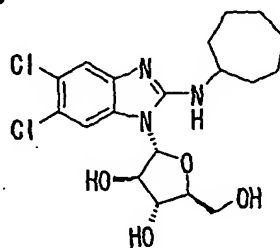
しかし、これら公報には本明細書中に開示の化合物は含まれず、またそれを示唆する記載も見られない。



化合物D



化合物E

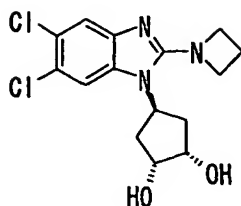


化合物F

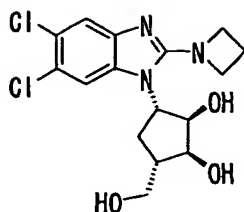
ベンゾイミダゾール骨格を有する抗肝炎ウイルス剤としては、特表2000-503017号(WO97/25316号)及び特表平10-505092号(WO96/7646号)が公知である。

WO97/25316号には下記化合物A等が開示されており、その用途としてウイルス感染の治療が述べられている。また、対象となるウイルスとしてB型肝炎ウイルス等のDNAウイルスが挙げられている。しかし、当該公報には本明細書中に開示の化合物は含まれず、かつHCVに関する記載はなく、またそれを示唆する記載も見られない。

特表平10-505092号には下記化合物B等が開示されており、その用途としてウイルス感染の治療が述べられている。また、対象となるウイルスとしてDNAウイルスであるヘルペスウイルス及びB型肝炎ウイルスが記載されている。しかし、当該公報にも本明細書中に開示の化合物は含まれず、かつHCVに関する記載、またそれを示唆する記載も見られない。



化合物A



化合物B

抗ウイルス活性を有するベンゾイミダゾール誘導体は、特開平3-31264号、US3644382号及びUS3778504号にも記載されている。また、WO98/37072号には腫瘍壊死因子（TNF）及びサイクリックAMPの産生阻害物質として、ベンゾイミダゾール誘導体の抗ヒト免疫不全ウイルス（HIV）剤及び抗炎症剤への利用が記載されている。また、WO98/05327号には逆転写酵素阻害剤として、ベンゾイミダゾール誘導体の抗HIV剤への利用が記載されている。また、J. Med. Chem. (13(4), 697-704, 1970) にはノイラミニダーゼ阻害剤として、ベンゾイミダゾール誘導体の抗インフルエンザウイルス剤への利用が記載されている。

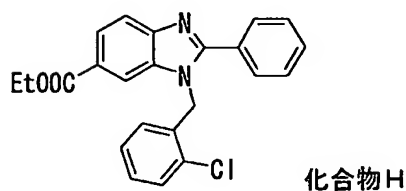
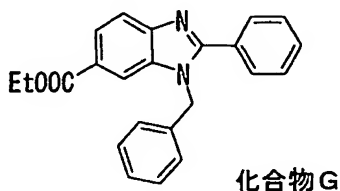
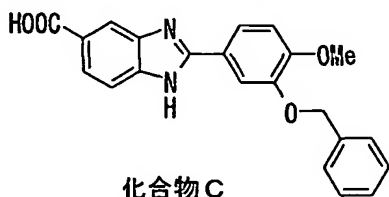
しかし、何れの文献にも本発明化合物は含まれず、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載も見られない。

抗ウイルス剤以外の医薬用途を有するベンゾイミダゾール誘導体として、特開平8-501318号（US5814651号）及び特開平8-134073号（US5563143号）が公知である。当該公報にはカテコールジェーテル化合物として下記化合物C等が開示されており、抗炎症剤としての使用について記載されている。しかし、両公報ともに本発明化合物を含まず、その作用機序としては、前者にはホスホジエステラーゼIVが、後者にはTNFが記載されているのみであり、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載は見られない。

また、特表2000-159749号（EP882718号）には、下記化合物G等が開示されており、気管支炎、腎炎等への治療用途が記載されている。しかし、当該公報は本発明化合物を含まず、ホスホジエステラーゼIV阻害及び血糖降下活性が記載されているのみであり、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載は見られない。

また、US6211177号には、下記化合物H等が開示されており、抗腫瘍

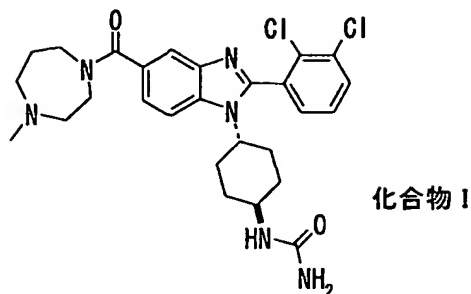
剤への利用が記載されている。しかし、当該公報は本発明化合物を含まず、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載も見られない。



また、WO98/50029号、WO98/50030号及びWO98/50031号には、プロテインイソプレニル転移酵素作用を有する抗癌剤としてベンゾイミダゾール誘導体が記載されている。当該公報には、広範な請求の範囲が記載されるが、少なくとも本発明化合物と類似する化合物は記載されておらず、抗HCV作用に関する記載またそれを示唆する記載も見られない。

また、特開平8-109169号（EP694535号）にはタキキニン受容体拮抗物質の炎症性疾患への適用が、WO96/35713号には成長ホルモン放出促進剤としての骨粗鬆症等の成長ホルモン関連疾患への適用が記載されている。しかし、何れの公報にも抗HCV作用に関する記載はなく、それを示唆する記載も見られない。

また、WO2001/21634号には、ケミカルライブラリーとして、下記化合物Iが開示されている。しかし、当該公報は本発明化合物を含まず、一部化合物の抗微生物活性が記載されてはいるものの、抗HCV作用に関する記載はなく、それを示唆する記載も見られない。



医薬用途以外にも特開昭 53-14735 号には、光沢剤としてベンゾイミダゾール誘導体が記載されてはいるが、これも本発明化合物を包含するものではない。

#### 発明の開示

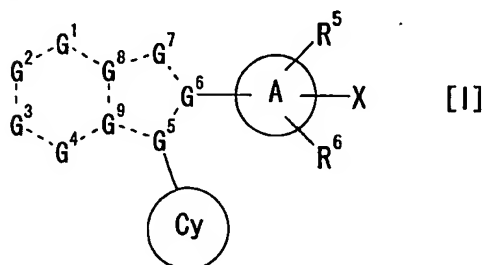
これまでの研究で得られた知見により抗 HCV 作用を有する薬剤は、C 型肝炎の予防及び治療に有効であり、特に HCV の有する RNA 依存性 RNA ポリメラーゼ阻害作用を有する抗 HCV 剤は有効な C 型肝炎の予防及び治療剤、また C 型肝炎に起因する疾患の予防及び治療剤に成り得ることが明らかになった。

従って、本発明は、抗 HCV 作用を有する薬剤、特に RNA 依存性 RNA ポリメラーゼ阻害作用を有する薬剤を提供することを課題とする。

本発明者らは、抗 HCV 作用、特に RNA 依存性 RNA ポリメラーゼ阻害作用を有する化合物を見出すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明を完成するに至った。

より詳しくは下記 (1) 乃至 (87) に示す通りである。

(1) 下記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る C 型肝炎治療剤。



[式中、破線は単結合又は二重結合であり、

G<sup>1</sup>は、C(−R<sup>1</sup>)又は窒素原子であり、

G<sup>2</sup>は、C(−R<sup>2</sup>)又は窒素原子であり、

$G^3$ は、 $C(-R^3)$ 又は窒素原子であり、

$G^4$ は、 $C(-R^4)$ 又は窒素原子であり、

$G^5$ 、 $G^6$ 、 $G^8$ 及び $G^9$ は、それぞれ独立して、炭素原子又は窒素原子であり、

$G^7$ は、 $C(-R^7)$ 、酸素原子、硫黄原子、又は $R^8$ で置換されてもよい窒素原子であり、

ここで、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)C1-6 アルカノイル基、

(3)カルボキシ基、

(4)シアノ基、

(5)ニトロ基、

(6)下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC1-6 アルキル基、

グループA；ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、C1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシC1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシカルボニル基及びC1-6 アルキルアミノ基。

(7) $-COOR^{a1}$ 、

ここで $R^{a1}$ は、置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基、又はグルクロン酸残基を意味する。

グループB；ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6 アルキル基、ハロゲン化C1-6 アルキル基、C1-6 アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

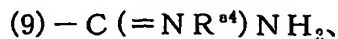
ここで $R^{b1}$ 及び $R^{b2}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6 アルキル基を意味し、 $r$ は0又は1乃至6の整数である。

(8) $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで $R^{a2}$ 及び $R^{a3}$ は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6 アルコキシ基又は



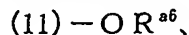
置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。



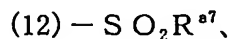
ここで $R^{a4}$ は、水素原子又は水酸基を意味する。



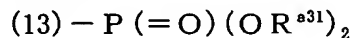
ここで $R^{a6}$ は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル基を意味する。



ここで $R^{a6}$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。



ここで $R^{a7}$ は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。



ここで $R^{a31}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

又は、

(14) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

$R^7$ 及び $R^8$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）であり、

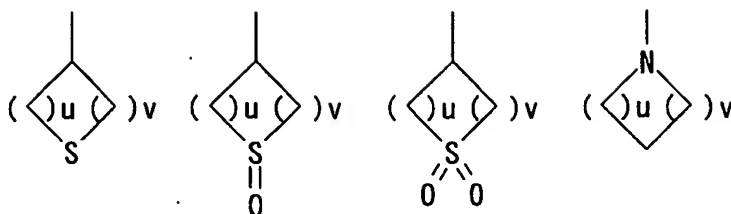
環Cyは、

(1) 下記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、

グループC; 水酸基、ハロゲン原子、C1-6アルキル基及びC1-6アルコキシ基。

(2) 前記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルケニル基又は、

(3)



(式中、u 及び v は、それぞれ独立して 1 乃至 3 の整数を表す。) であり、  
環 A は、

- (1) C6-14 アリール基、
- (2) C3-8 シクロアルキル基、
- (3) C3-8 シクロアルケニル基、又は、
- (4) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

R<sup>5</sup> 及び R<sup>6</sup> は、それぞれ独立して、

- (1) 水素原子、
- (2) ハロゲン原子、
- (3) 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、又は、
- (4) -OR<sup>8</sup>

ここで R<sup>8</sup> は、水素原子、C1-6 アルキル基又は C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

であり、

X は、

- (1) 水素原子、
- (2) ハロゲン原子、
- (3) シアノ基、
- (4) ニトロ基、
- (5) アミノ基、C1-6 アルカノイルアミノ基、
- (6) C1-6 アルキルスルホニル基、
- (7) 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、
- (8) 前記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい C2-6

アルケニル基、

(9)  $-\text{COOR}^{\text{a9}}$ 、

ここで $\text{R}^{\text{a9}}$ は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

(10)  $-\text{CONH}-(\text{CH}_2)_1-\text{R}^{\text{a10}}$ 、

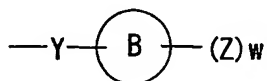
ここで $\text{R}^{\text{a10}}$ は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、C1-6アルコキシカルボニル基又はC1-6アルカノイルアミノ基であり、1は、0又は1乃至6の整数を意味する。

(11)  $-\text{OR}^{\text{a11}}$ 、

ここで $\text{R}^{\text{a11}}$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

又は、

(12)



{式中、環Bは、

(1') C6-14アリール基、

(2') C3-8シクロアルキル基、又は、

(3') ヘテロ環基（前記定義の通り。）であり、

Zは、それぞれ独立して、

(1') 下記グループDから選ばれる基、

(2') 下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(3') 下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、

(4') 下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(5') 下記グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選ばれる1乃至

4 個のヘテロ原子を含む。

又は、

(6') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環 C1-6 アルキル基、

ここで当該ヘテロ環 C1-6 アルキル基は、前記定義の通りの「グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換された C1-6 アルキル基を意味する。

であり、

グループD：

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

(c) シアノ基、

(d) ニトロ基、

(e) 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、

(f)  $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、

以下、 $t$  は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

ここで  $R^{a18}$  は、

(1'') 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、

(2'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、又は、

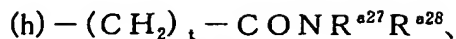
(3'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含む。

であり、

(g)  $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、

ここで  $R^{a19}$  は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基 C1-6 アルキル基を意味する。



ここで $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6アルキル基を意味する。

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、

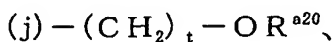
(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基、

(9'')水酸基、又は、

(10'')C1-6アルコキシ基であり、



ここで $R^{a33}$ は、水素原子、C1-6アルキル基、水酸基又はC1-6アルコキシ基を意味する。



ここで $R^{a20}$ は、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')置換されてもよいC2-6アルケニル基（前記定義の通り。）、

(4'')前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい  
C2-6 アルキニル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C6-14 アリール基、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C6-14 アリールC1-6 アルキル基、

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
ヘテロ環基、

(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
ヘテロ環C1-6 アルキル基、

(9'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C3-8 シクロアルキル基、又は、

(10'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C3-8 シクロアルキルC1-6 アルキル基であり、

(k)  $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$ 、

ここで $R^{a21}$ は、アミノ基、C1-6 アルキルアミノ基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、pは0又は1乃至6の整数を意味する。

(l)  $-(CH_2)_t-NR^{a22}R^{a23}$ 、

ここで $R^{a22}$ 及び $R^{a23}$ は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、

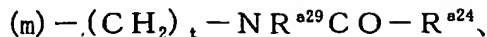
(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C6-14 アリール基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C6-14 アリールC1-6 アルキル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
ヘテロ環C1-6 アルキル基、又は、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい

ヘテロ環基であり、



ここで $R^{a29}$ は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味し、

$R^{a24}$ は、

(1'')アミノ基、

(2'')C1-6アルキルアミノ基、

(3'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

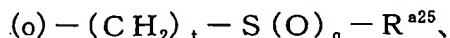
(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、又は、

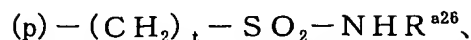
(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、を意味する。



ここで $R^{a29}$ は前記定義の通りであり、 $R^{a25}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで $R^{a25}$ は前記定義の通りであり、 $q$ は0、1又は2である。



ここで $R^{a26}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

及び、

(q)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

wは、1乃至3の整数であり、

Yは、

(1') 単結合、

(2') C1-6 アルキレン、

(3') C2-6 アルケニレン、

(4')  $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、

以下、m及びnは、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。

(5')  $-CO-$ 、

(6')  $-CO_2-(CH_2)_n-$ 、

(7')  $-CONH-(CH_2)_n-NH-$ 、

(8')  $-NHCO_2-$ 、

(9')  $-NHCONH-$ 、

(10')  $-O-(CH_2)_n-CO-$ 、

(11')  $-O-(CH_2)_n-O-$ 、

(12')  $-SO_2-$ 、

(13')  $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、

ここで $R^{a12}$ は、

(1'') 水素原子、

(2'') 置換されてもよいC1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3'') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基、

(4'') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基、

(5'')  $-COR^{b5}$ 、

ここで $R^{b5}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

(6'')  $-COOR^{b5}$  ( $R^{b5}$ は前記定義の通り。)、又は、



(7'')-SO<sub>2</sub>R<sup>b5</sup> (R<sup>b5</sup>は前記定義の通り。)、

(14')-NR<sup>a12</sup>CO- (R<sup>a12</sup>は前記の定義と同じ。)、

(15')-CONR<sup>a13</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、

ここでR<sup>a13</sup>は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

(16')-CONH-CHR<sup>a14</sup>-、

ここでR<sup>a14</sup>は、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基を意味する。

(17')-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-CR<sup>a15</sup>R<sup>a16</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、

ここでR<sup>a15</sup>及びR<sup>a16</sup>は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')カルボキシ基、

(3'')C1-6アルキル基、

(4'')-OR<sup>b6</sup>、

ここでR<sup>b6</sup>は、C1-6アルキル基又はC6-14アリールC1-6アルキル基を意味する。

又は、

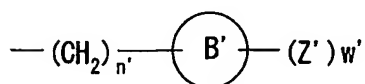
(5'')-NHR<sup>b7</sup>

ここでR<sup>b7</sup>は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリールC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にR<sup>a15</sup>は、

(6'')



であってもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なってもよい。

(18')  $-(CH_2)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-$  ( $R^{a12}$  及び  $R^{a15}$  は、それぞれ前記定義の通り。)、

(19')  $-NR^{a17}SO_2-$

ここで  $R^{a17}$  は、水素原子又は C1-6 アルキル基を意味する。

(20')  $-S(O)_e-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  ( $e$  は 0、1 又は 2 であり、 $R^{a15}$  及び  $R^{a16}$  は、それぞれ前記定義の通り。)、又は、

(21')  $-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  ( $R^{a15}$  及び  $R^{a16}$  は、それぞれ前記定義の通り。)

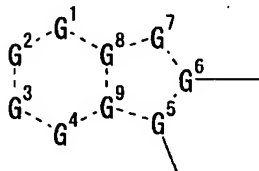
である。} である。]

(2)  $G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、 $G^4$ 、 $G^5$ 、 $G^6$ 、 $G^7$ 、 $G^8$  及び  $G^9$  のうち 1 乃至 4 個が窒素原子である (1) 記載の C 型肝炎治療剤。

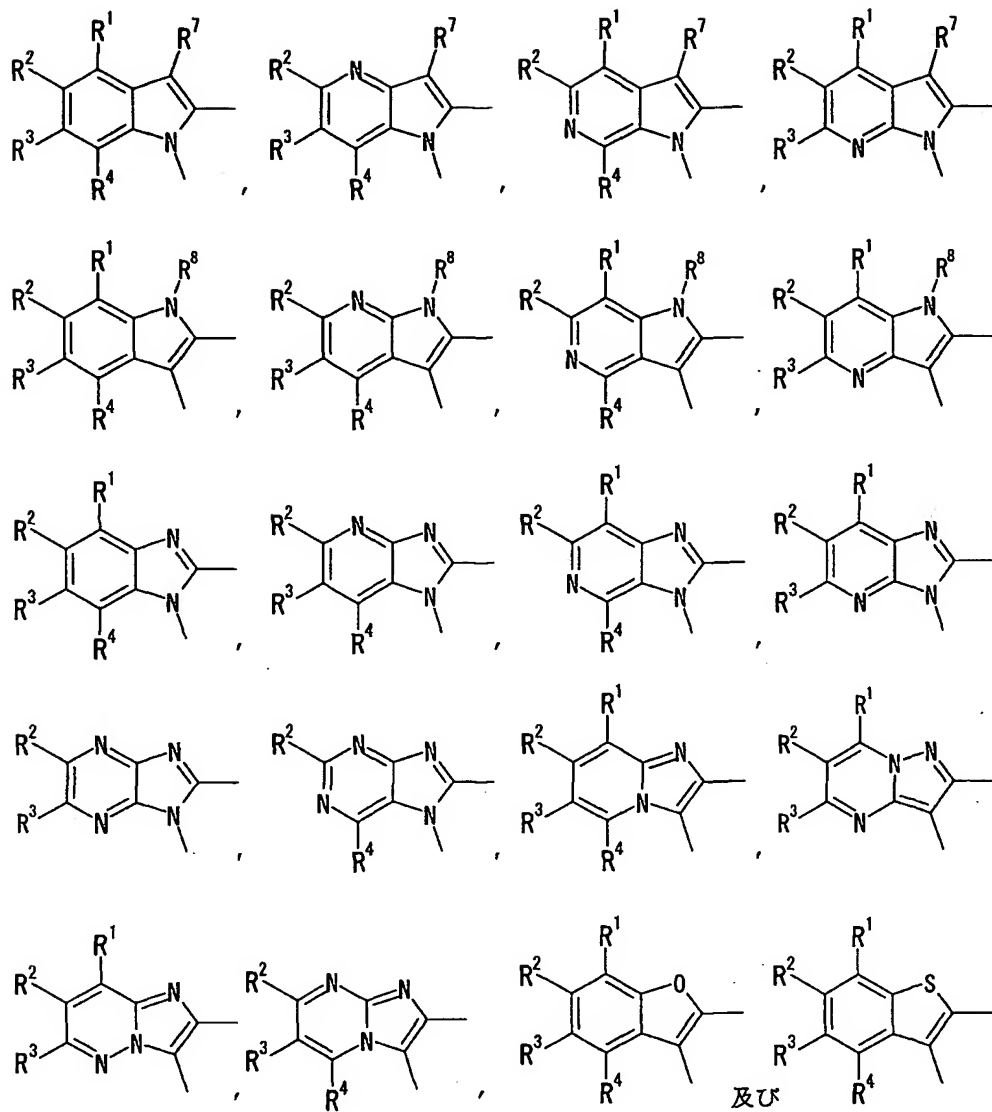
(3)  $G^2$  が C ( $-R^2$ ) であり、 $G^6$  が炭素原子である (2) 記載の C 型肝炎治療剤。

(4)  $G^5$  が窒素原子である (2) 又は (3) 記載の C 型肝炎治療剤。

(5) 一般式 [I] の

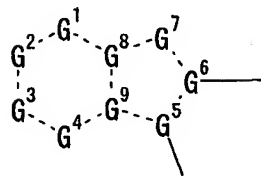


部位が、

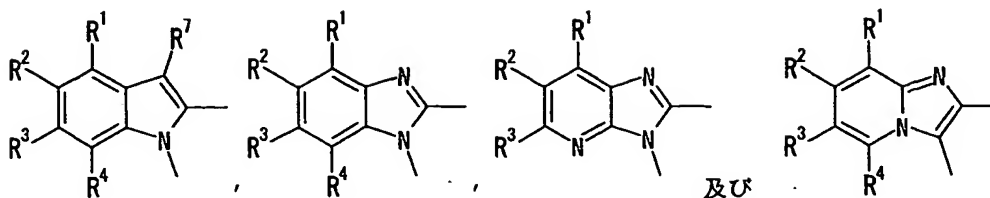


からなる群より選ばれる縮合環である (1) 記載の C 型肝炎治療剤。

(6) 一般式 [I] の

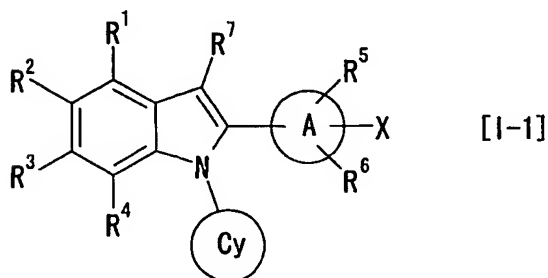


部位が、



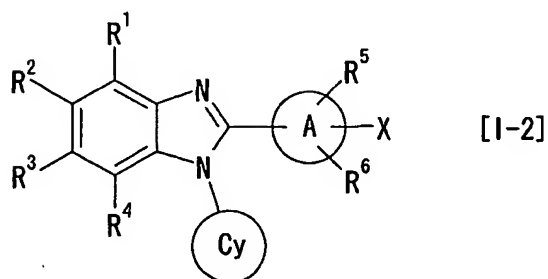
からなる群より選ばれる縮合環である（５）記載のＣ型肝炎治療剤。

（７） 下記一般式〔Ｉ－１〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る（６）記載のＣ型肝炎治療剤。



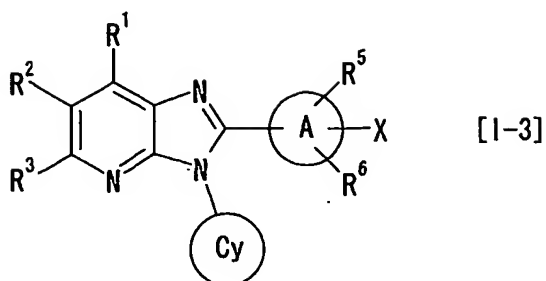
（式中、各記号は（１）記載の通りである。）

（８） 下記一般式〔Ｉ－２〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る（６）記載のＣ型肝炎治療剤。



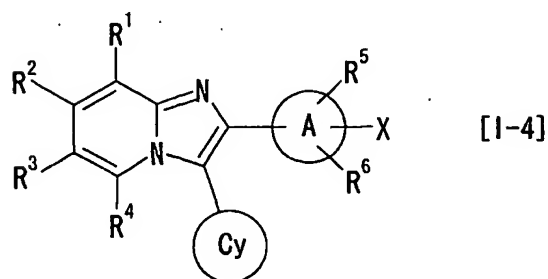
（式中、各記号は（１）記載の通りである。）

（９） 下記一般式〔Ｉ－３〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る（６）記載のＣ型肝炎治療剤。



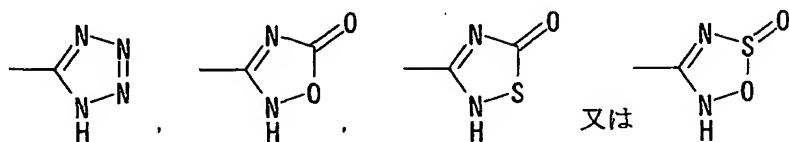
(式中、各記号は(1)記載の通りである。)

(10) 下記一般式[I-4]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る(6)記載のC型肝炎治療剤。



(式中、各記号は(1)記載の通りである。)

(11)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ のうち少なくとも1つが、カルボキシル基、 $-\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{CONR}^{a2}\text{R}^{a3}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{a7}$  ( $R^{a1}$ 、 $R^{a2}$ 、 $R^{a3}$ 及び $R^{a7}$ は(1)記載の通りである。)、



である(1)乃至(10)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

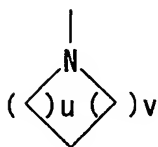
(12)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ のうち少なくとも1つが、カルボキシル基、 $-\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{CONR}^{a2}\text{R}^{a3}$ 又は $-\text{SO}_2\text{R}^{a7}$  ( $R^{a1}$ 、 $R^{a2}$ 、 $R^{a3}$ 及び $R^{a7}$ は(1)記載の通りである。)である(11)に記載のC型肝炎治療剤。

(13)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ のうち少なくとも1つが $-\text{COOR}^{a1}$ であり、 $R^{a1}$ がグルクロン酸残基である(1)乃至(10)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(14)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ のうち少なくとも1つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である(1)乃至(10)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(15) 環Cyが、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、テトラヒドロチオピラニル基又はピペリジノ基である(1)乃至(14)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(16) 環Cyが、



(式中、各記号は(1)記載の通りである。)である(1)乃至(14)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

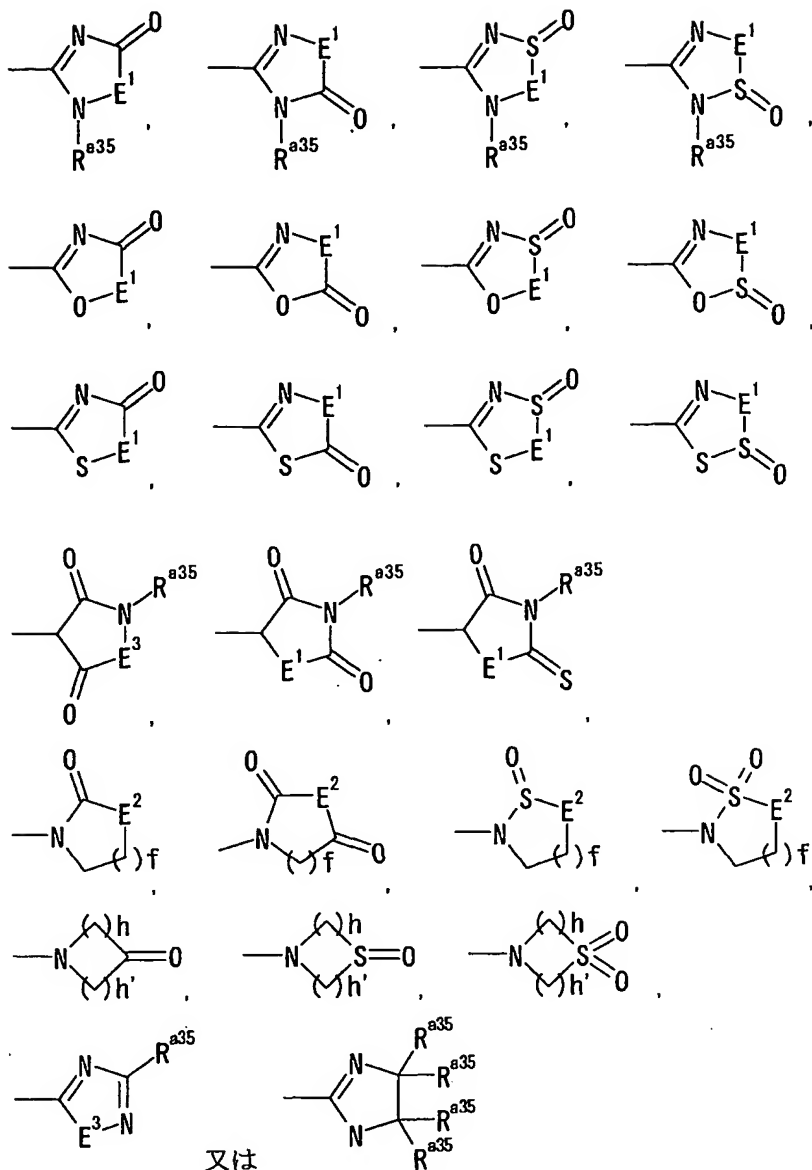
(17) 環Aが、C6-14アリール基である(1)乃至(16)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(18) グループAによって置換されてもよい置換基のうち少なくとも何れか1つが、C1-6アルコキシC1-6アルコキシ基で置換された置換基である(1)乃至(17)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(19) Yが、 $-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  (各記号は、(1)記載の通りである。)である(1)乃至(17)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

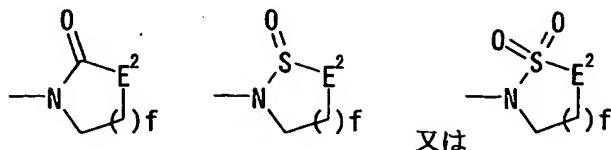
(20) Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(21) Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



(式中、 $E^1$ は酸素原子、硫黄原子又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^2$ は酸素原子、 $CH_2$ 又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^3$ は酸素原子又は硫黄原子であり、ここで $R^{a35}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基であり、 $f$ は1乃至3の整数であり、 $h$ 及び $h'$ はそれぞれ同一若しくは異なって1乃至3の整数である。)である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(22) Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



(式中、各記号は(21)記載の通りである。)である(21)に記載のC型肝炎治療剤。

(23) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$  (各記号は、(1)記載の通りである。)であり、 $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ の少なくとも何れか一方が、C1-6アルコキシ基である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(24) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-C(=NR^{a33})NH_2$  (各記号は、(1)記載の通りである。)であり、 $R^{a33}$ が水酸基又はC1-6アルコキシ基である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(25) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$  (各記号は、(1)記載の通りである。)であり、 $R^{a21}$ がアミノ基である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

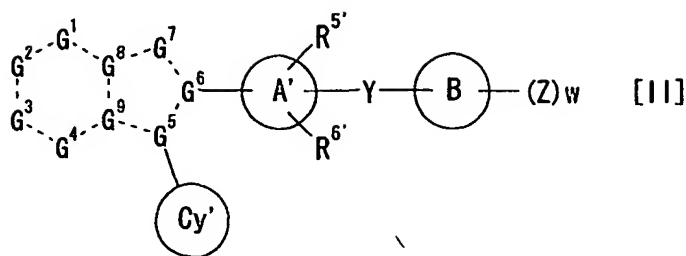
(26) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$  (各記号は、(1)記載の通りである。)であり、 $R^{a24}$ がアミノ基又はC1-6アルキルアミノ基である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(27) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-NR^{a22}R^{a23}$  (各記号は、請求項1記載の通りである。)であり、 $R^{a22}$ 及び $R^{a23}$ の少なくとも何れか一方が、アミノ基又はC1-6アルキルアミノ基である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

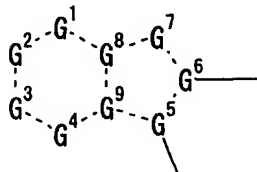
(28) グループDの少なくとも一つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である(1)乃至(19)のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

(29) 下記一般式[II]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

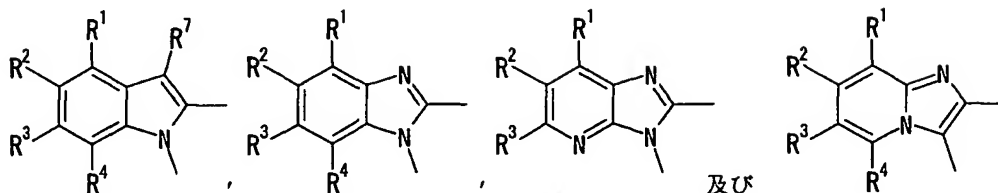




[式中、



部位は、



からなる群より選ばれる縮合環であり、

ここで、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) C1-6 アルカノイル基、

(3) カルボキシル基、

(4) シアノ基、

(5) ニトロ基、

(6) 下記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい C1-6 アルキル基、

グループ A ; ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基、アミノ基、C1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシC1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシカルボニル基 及び C1-6 アルキルアミノ基。

(7)  $-\text{COOR}^{a1}$ 、

ここで  $R^{a1}$  は、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、下記

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基、又はグルクロン酸残基を意味する。

グループB；ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで $R^{b1}$ 及び $R^{b2}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基を意味し、 $r$ は0又は1乃至6の整数である。

(8)  $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで $R^{a2}$ 及び $R^{a3}$ は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(9)  $-C(=NR^{a4})NH_2$ 、

ここで $R^{a4}$ は、水素原子又は水酸基を意味する。

(10)  $-NHR^{a5}$ 、

ここで $R^{a5}$ は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル基を意味する。

(11)  $-OR^{a6}$ 、

ここで $R^{a6}$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(12)  $-SO_2R^{a7}$ 、

ここで $R^{a7}$ は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。

(13)  $-P(=O)(OR^{a31})_2$

ここで $R^{a31}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

又は、

(14) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を

含んでなるヘテロ環基であり、

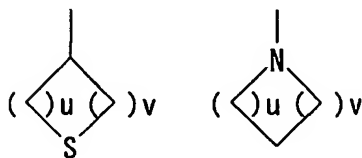
$R^7$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）であり、

環C $y'$ は、

(1) 下記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基

グループC; 水酸基、ハロゲン原子、C1-6アルキル基及びC1-6アルコキシ基。  
又は、

(2)



(式中、u及びvは、それぞれ独立して1乃至3の整数を表す。)であり、  
環A'は、

(1) フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれる基であり、

$R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

(3) 置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、又は、

(4) 水酸基

であり、

環Bは、

(1) C6-14アリール基、

(2) C3-8シクロアルキル基、又は、

(3) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

Zは、それぞれ独立して、

- (1) 下記グループDから選ばれる基、
- (2) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、
- (3) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル基、
- (4) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、又は、
- (5) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含む。

又は、

- (6) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環 C1-6 アルキル基、

ここで当該ヘテロ環 C1-6 アルキル基は、前記定義の通りの「グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換された C1-6 アルキル基を意味する。

であり、

グループD：

- (a) 水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c) シアノ基、
- (d) ニトロ基、
- (e) 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、
- (f)  $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、

以下、tは、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。

ここでR<sup>a18</sup>は、

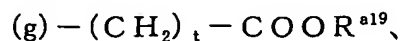
- (1') 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、

(2') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、又は、

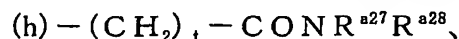
(3') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

であり、



ここで $R^{a19}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基C1-6アルキル基を意味する。



ここで $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ は、それぞれ独立して、

(1') 水素原子、

(2') 置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、

(4') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリールC1-6アルキル基、

(5') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

(6') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6アルキル基を意味する。

(7') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 3-8 シクロアルキル基、

(8') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC

3-8 シクロアルキル C1-6 アルキル基、

(9') 水酸基、又は、

(10') C1-6 アルコキシ基であり、

(i)  $-(CH_2)_t-C(=NR^{a33})NH_2$ 、

ここで  $R^{a33}$  は、水素原子、C1-6 アルキル基、水酸基又は C1-6 アルコキシ基を意味する。

(j)  $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、

ここで  $R^{a20}$  は、

(1') 水素原子、

(2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3') 置換されてもよい C2-6 アルケニル基 (前記定義の通り。)、

(4') 前記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい C2-6 アルキニル基、

(5') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、

(6') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、

(7') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

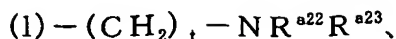
(8') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環 C1-6 アルキル基、

(9') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル基、又は、

(10') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル C1-6 アルキル基であり、

(k)  $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$ 、

ここで  $R^{a21}$  は、アミノ基、C1-6 アルキルアミノ基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、 $p$  は 0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。



ここで $R^{a22}$ 及び $R^{a23}$ は、それぞれ独立して、

(1')水素原子、

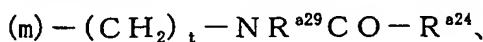
(2')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、又は、

(6')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



ここで $R^{a29}$ は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味し、

$R^{a24}$ は、

(1')アミノ基、

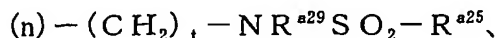
(2')C1-6アルキルアミノ基、

(3')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

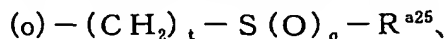
(5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、又は、

(6')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、を意味する。

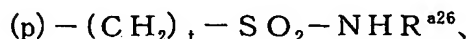


ここで $R^{a29}$ は前記定義の通りであり、 $R^{a25}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる

1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで  $R^{a25}$  は前記定義の通りであり、 $q$  は 0、1 又は 2 である。



ここで  $R^{a26}$  は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

及び、

(q) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

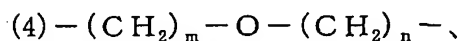
$w$  は、1 乃至 3 の整数であり、

$Y$  は、

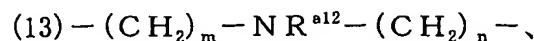
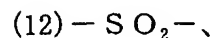
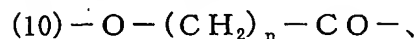
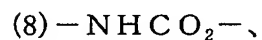
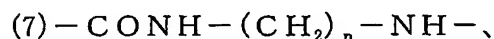
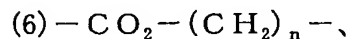
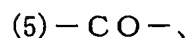
(1) 単結合、

(2) C1-6 アルキレン、

(3) C2-6 アルケニレン、



以下、 $m$  及び  $n$  は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。



ここで  $R^{a12}$  は、

(1') 水素原子、



(2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、

(4') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、

(5')  $-COR^{b5}$ 、

ここで  $R^{b5}$  は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(6')  $-COOR^{b5}$  ( $R^{b5}$  は前記定義の通り。)、又は、

(7')  $-SO_2R^{b5}$  ( $R^{b5}$  は前記定義の通り。)、

(14)  $-NR^{a12}CO-$  ( $R^{a12}$  は前記の定義と同じ。)、

(15)  $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、

ここで  $R^{a13}$  は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)) 又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(16)  $-CONH-CHR^{a14}-$ 、

ここで  $R^{a14}$  は、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基を意味する。

(17)  $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 、

ここで  $R^{a15}$  及び  $R^{a16}$  は、それぞれ独立して、

(1') 水素原子、

(2') カルボキシ基、

(3') C1-6 アルキル基、

(4')  $-OR^{b6}$ 、

ここで  $R^{b6}$  は、C1-6 アルキル基又は C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

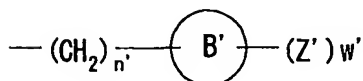
又は、



ここで $R^{b7}$ は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリールC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更に $R^{a15}$ は、



であってもよく、

ここで $n'$ 、環 $\text{B}'$ 、 $\text{Z}'$ 及び $w'$ は、それぞれ上記 $n$ 、環 $\text{B}$ 、 $\text{Z}$ 及び $w$ と同義であり、それぞれ $n$ 、環 $\text{B}$ 、 $\text{Z}$ 及び $w$ と同一若しくは異なってもよい。

(18)  $-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}^{a12}-\text{CHR}^{a15}-$  ( $R^{a12}$ 及び $R^{a15}$ は、それぞれ前記定義の通り。)、

(19)  $-\text{NR}^{a17}\text{SO}_2-$ 、

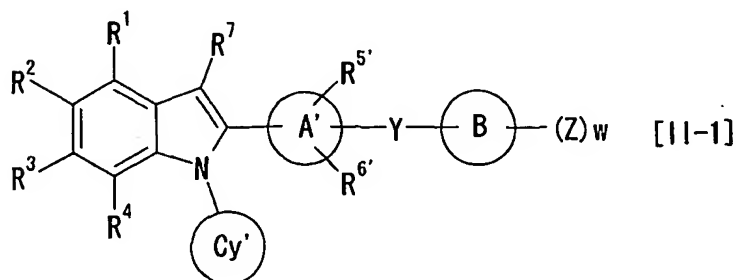
ここで $R^{a17}$ は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

(20)  $-\text{S}(\text{O})_e-(\text{CH}_2)_m-\text{CR}^{a15}\text{R}^{a16}-(\text{CH}_2)_n-$  ( $e$ は0、1又は2であり、 $R^{a15}$ 及び $R^{a16}$ は、それぞれ前記定義の通り。)、又は、

(21)  $-(\text{CH}_2)_m-\text{CR}^{a16}\text{R}^{a16}-(\text{CH}_2)_n-$  ( $R^{a15}$ 及び $R^{a16}$ は、それぞれ前記定義の通り。)

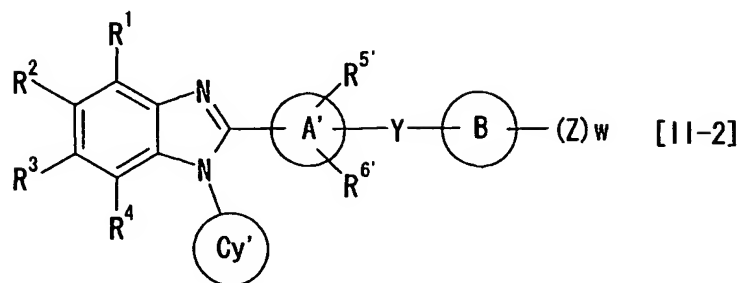
である。]

(30) 下記一般式 [II-1] で表される (29) 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



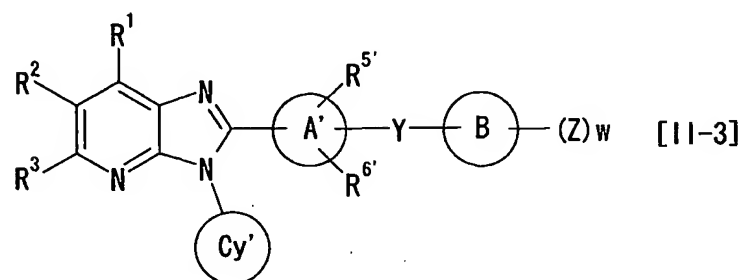
(式中、各記号は (29) 記載の通りである。)

(31) 下記一般式 [II-2] で表される (29) 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



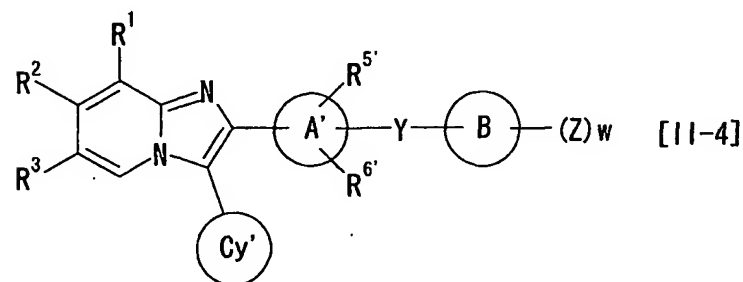
(式中、各記号は (29) 記載の通りである。)

(32) 下記一般式 [II-3] で表される (29) 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は (29) 記載の通りである。)

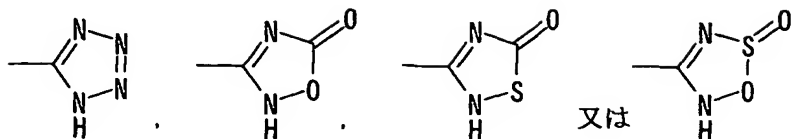
(33) 下記一般式 [II-4] で表される (29) 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は (29) 記載の通りである。)

(34)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシル基、 $-\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{CONR}^{a2}\text{R}^{a3}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{a7}$  ( $R^{a1}$ 、 $R^{a2}$ 、 $R^{a3}$  及び  $R^{a7}$  は (29)

記載の通りである。)、



である (29) 乃至 (33) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(35)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシ基、 $-\text{COOR}^{a1}$  又は  $-\text{SO}_2\text{R}^{a7}$  (ここで  $R^{a1}$  及び  $R^{a7}$  は (29) 記載の通り。) である (34) に記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(36)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシ基又は  $-\text{COOR}^{a1}$  (ここで  $R^{a1}$  は (29) 記載の通り。) である (35) 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(37)  $R^2$  がカルボキシ基であり、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  が水素原子である (36) 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

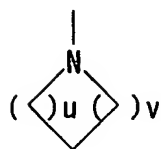
(38)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが  $-\text{COOR}^{a1}$  であり、 $R^{a1}$  がグルクロン酸残基である (29) 乃至 (33) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(39)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である (29) 乃至 (33) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(40) 環  $\text{Cy}'$  が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基又はテトラヒドロチオピラニル基である (29) 乃至 (39) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(41) 環  $\text{Cy}'$  が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基である (40) 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(42) 環  $\text{Cy}'$  が、



(式中、各記号は(29)記載の通りである。)である(29)乃至(39)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(43) 環A'が、フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基又はピリダジニル基である(29)乃至(42)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(44) 環A'が、フェニル基又はピリジル基である(43)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(45) 環A'が、フェニル基である(44)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(46) グループAによって置換されてもよい置換基のうち少なくとも何れか1つが、C1-6アルコキシC1-6アルコキシ基で置換された置換基である(29)乃至(45)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(47) Yが、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、 $-NHCO_2-$ 、 $-CONH-CHR^{a14}-$ 、 $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、 $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、 $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 又は $-(CH_2)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-$ (ここで各記号は(29)記載の通り。)である(29)乃至(46)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(48) Yが、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 又は $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ (ここで各記号は(29)記載の通り。)である(47)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

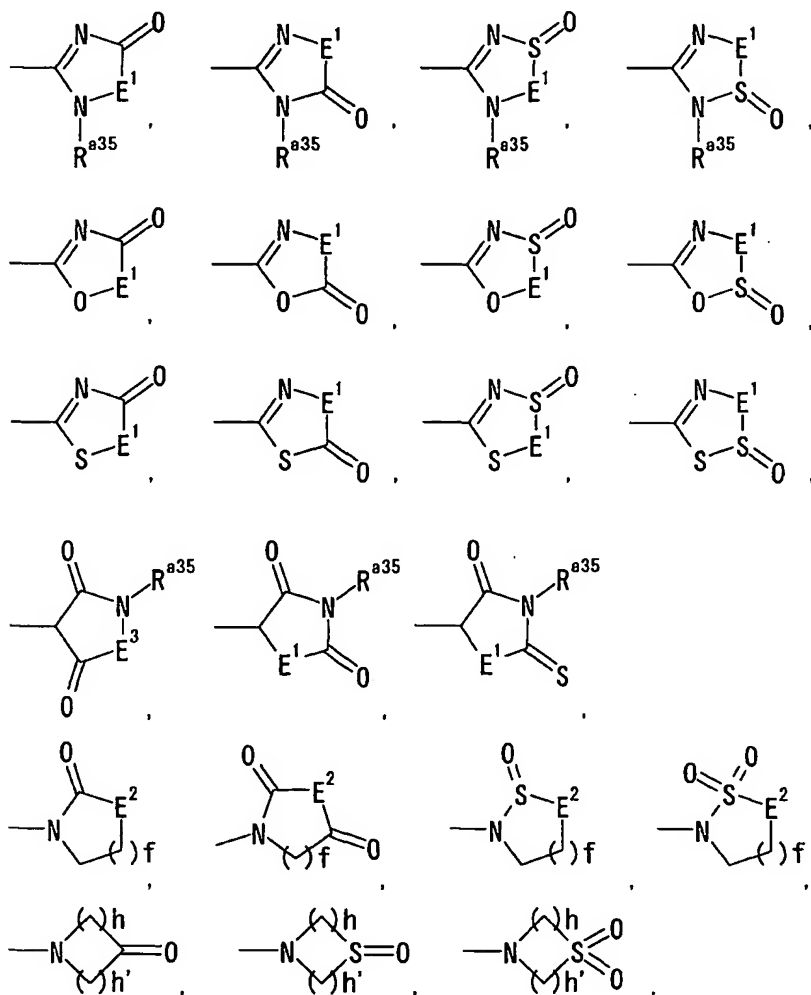
(49) Yが、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ (ここで各記号は(29)記載の通り。)である(48)記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

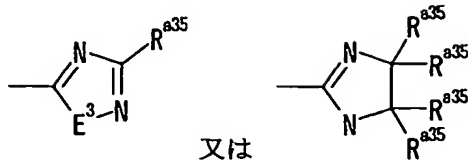
(50) Yが、 $-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ (各記号は、(29)記載の通りである。)である(29)乃至(46)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(51)  $R^2$ がカルボキシル基であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ が水素原子であり、環 $Cy'$ がシクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、環 $A'$ がフェニル基である(29)乃至(50)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(52)  $Z$ の少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

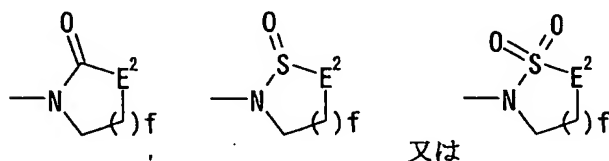
(53)  $Z$ の少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、





(式中、 $E^1$ は酸素原子、硫黄原子又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^2$ は酸素原子、 $CH_2$ 又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^3$ は酸素原子又は硫黄原子であり、ここで $R^{a35}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基であり、 $f$ は1乃至3の整数であり、 $h$ 及び $h'$ はそれぞれ同一若しくは異なって1乃至3の整数である。)である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(54) Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



(式中、各記号は(53)記載の通りである。)である(53)に記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(55) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$  (各記号は、(29)記載の通りである。)であり、 $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ の少なくとも何れか一方が、C1-6アルコキシ基である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(56) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-C(=NR^{a33})NH_2$  (各記号は、(29)記載の通りである。)であり、 $R^{a33}$ が、水酸基又はC1-6アルコキシ基である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(57) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$  (各記号は、(29)記載の通りである。)であり、 $R^{a21}$ が、アミノ基である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(58) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$  (各記号は、(29)記載の通りである。)であり、 $R^{a24}$ が、アミノ基又はC1-6アルキルアミノ基である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は

製薬上許容されるその塩。

(59) グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_i-NR^{a22}R^{a23}$  (各記号は、(29)記載の通りである。)であり、 $R^{a22}$ 及び $R^{a23}$ の少なくとも何れか一方が、アミノ基又はC1-6アルキルアミノ基である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(60) グループDの少なくとも一つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である(29)乃至(51)のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(61) 2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例1)、

2-[4-(3-プロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例2)、

1-シクロヘキシル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例3)、

2-[4-(2-プロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例4)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例5)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例6)、

2-[4-(2-プロモ-5-メトキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例7)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(実施例8)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例9)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[(E)-2-フェニルビニル]フェニル}ベ



ンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (実施例10)、

1-シクロヘキシルー2-{4-[(E)-2-フェニルビニル]フェニル}ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 (実施例11)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 (実施例12)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボキサミド (実施例13)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-シアノ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例14)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボキサミドオキシム (実施例15)、

1-シクロヘキシルー2-{4-[{4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (実施例16)、

1-シクロヘキシルー2-{4-[{4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル}メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 (実施例17)、

1-シクロヘキシルー2-(2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (実施例18)、

2-{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (実施例19)、

2-{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸 (実施例20)、

1-シクロペンチルー2-(4-ニトロフェニル)ベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (実施例21)、

2-(4-アミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー5-カルボン酸エチルエステル (実施例22)、

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾ

ールー 5-カルボン酸エチルエステル (実施例 23)、

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸 (実施例 24)、

2-{4-[3-(3-クロロフェニル)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸エチルエステル (実施例 25)、

2-{4-[3-(3-クロロフェニル)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸 (実施例 26)、

2-[4-(3-アセトキシフェニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸エチルエステル (実施例 27)、

1-シクロヘキシルー 2-[4-(3-ヒドロキシフェニルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸エチルエステル (実施例 28)、

1-シクロヘキシルー 2-{4-[3-(4-ピリジルメトキシ)フェニルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸エチルエステル (実施例 29)、

1-シクロヘキシルー 2-{4-[3-(4-ピリジルメトキシ)フェニルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸 (実施例 30)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 31)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールー 5-カルボン酸エチルエステル (実施例 32)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N, N-ジメチルベンゾイミダゾールー 5-カルボキサミド (実施例 33)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N-メトキシ-N-メチルベンゾイミダゾールー 5-カルボキサミド (実施例 34)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)ベンゾイミダゾール (実施例 35)、

5-アセチルー 2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 36)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N-(2-ジメ

チルアミノエチル) ベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド 二塩酸塩 (実施例 37)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-ニトロベンゾイミダゾール (実施例 38)、

5-アミノ-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール 塩酸塩 (実施例 39)、

5-アセチルアミノ-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 40)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-メタンスルホンアミノベンゾイミダゾール (実施例 41)、

5-スルファモイル-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 42)、

2-[4-(4-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 43)、

2-[4-(4-カルボキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 44)、

2-[4-(4-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 45)、

2-{4-[(2-クロロ-5-チエニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 46)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 47)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メトキシベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 48)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-ピリジルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 49)、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 50)、

1-シクロペンチル-2-{4-[(3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル)

メトキシ} フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 51)、

1-シクロペンチル-2-(4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 52)、

[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニルアミノ酢酸 (実施例 53)、

2-[4-(2-クロロベンジルオキシ) フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 54)、

2-[4-(3-クロロベンジルオキシ) フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 55)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 56)、

2-[4-(ベンゼンスルホニルアミノ) フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 57)、

1-シクロペンチル-2-[4-(3, 5-ジクロロフェニルカルボニルアミノ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 58)、

2-{4-[(4-クロロフェニル) カルボニルアミノ] フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 59)、

2-{4-[(4-tert-ブチルフェニル) カルボニルアミノ] フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 60)、

2-{4-[(4-ベンジルオキシフェニル) カルボニルアミノ] フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 61)、

trans-4-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル] シクロヘキサン-1-オール (実施例 62)、

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-メトキシシクロヘキサン (実施例 63)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシメチル-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール (実施例 64)、

2-[1-ベンジルオキシカルボニル-4-ピペリジル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 65)、

2-[(4-シクロヘキシルフェニル)カルボニルアミノ]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例66)、

1-シクロペンチル-2-[4-(3,5-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例67)、

1-シクロペンチル-2-[4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例68)、

1-シクロペンチル-2-[4-(フェニルカルバモイルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例69)、

1-シクロペンチル-2-[4-(ジフェニルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例70)、

1-シクロペンチル-2-(4-フェネチルオキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例71)、

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-tert-ブチルシクロヘキサノール(実施例72)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシメトキシ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール(実施例73)、

2-(4-ベンジルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例74)、

2-[4-(N-ベンゼンスルホニル-N-メチルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例75)、

2-[4-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例76)、

1-シクロヘキシル-2-(4-フェネチルフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例77)、

2-(1-ベンジル-4-ピペリジル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例78)、

2-(1-ベンゾイル-4-ピペリジル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸(実施例79)、

1-シクロペンチル-2-[1-(p-トルエンスルホニル)-4-ピペリジル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例80)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3,5-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例81)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(ジフェニルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例82)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3,5-ジ-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例83)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-(4-メチルシクロヘキシル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例84)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(2-ナフチル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例85)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(1-ナフチル)メトキシフェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例86)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(ジベンジルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例87)、

2-[4-(2-ビフェニルメトキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例88)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例89)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(ジベンジルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例90)、

2-(4-ベンゾイルメトキシフェニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例91)、

2-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例92)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3,3-ジフェニルプロピルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例93)、

2-[4-(3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ)フェニル]-1-シ

クロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例94）、

2-（4-ベンジルオキシピペリジノ）-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例95）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔2-（フェノキシ）エトキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例96）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-（3-フェニルプロピルオキシ）フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例97）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-（5-フェニルペンチルオキシ）フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例98）、

2-（3-ベンジルオキシ-5-イソオキサゾリル）-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例99）、

2-（2-ベンジルオキシ-5-ピリジル）-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例100）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔2-（3, 4, 5-トリメトキシフェニル）エトキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例101）、

2-（4-ベンジルオキシフェニル）-1-（4, 4-ジメチルシクロヘキシル）ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例102）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-〔2-（1-ナフチル）エトキシ〕フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例103）、

2-〔4-（2-ベンジルオキシフェノキシ）フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例104）、

2-〔4-（3-ベンジルオキシフェノキシ）フェニル〕-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例105）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-（2-ヒドロキシフェノキシ）フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例106）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-（3-ヒドロキシフェノキシ）フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例107）、

1-シクロヘキシル-2-〔4-（2-メトキシフェノキシ）フェニル〕ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例108）、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 109)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 110)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 111)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 112)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 113)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 114)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 115)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンゾ[b, f]アゼピン-5-イル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 116)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 117)、

2-{4-[ビス(4-クロロフェニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 118)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 119)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(2-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 120)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 121)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロヘプチルベンゾイミダゾール



ルー 5-カルボン酸 (実施例 122)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-フェネチルオキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 123)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェネチルオキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 124)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2, 2-ジフェニルエトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 125)、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-(3-シクロヘキセニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 126)、

cis-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-フルオロシクロヘキサン (実施例 127)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-フェノキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 128)、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェノキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 129)、

2-{4-[(2R)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-2-フェニルエトキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 130)、

1-シクロヘキシル-2-{2-フルオロ-4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 131)、

2-[4-(4-ベンジルオキシフェノキシ) フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 132)、

2-{4-[ビス(4-メチルフェニル) メトキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 133)、

2-{4-[ビス(4-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 134)、

1-シクロヘキシル-6-メトキシ-2-[4-(3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 135)、

1-シクロヘキシル-6-ヒドロキシ-2-[4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例136)、

1-シクロヘキシル-6-メチル-2-[4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例137)、

2-{4-[2-(2-ベンジルオキシフェニル)エトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例138)、

2-{4-[2-(3-ベンジルオキシフェニル)エトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例139)、

2-[4-(2-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例140)、

2-[4-(3-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例141)、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例142)、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メトキシフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例143)、

1-シクロヘキシル-2-{2-メチル-4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例144)、

2-{4-[2-(4-tert-ブチルフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例145)、

2-{4-(3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ)-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例146)、

2-{4-[3-クロロ-6-(3,5-ジクロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例

147)、

2- {4- [ビス (4-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例148)、

2- {4- (4-ベンジルオキシフェノキシ) -2-クロロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例149)、

2- {4- (4-ベンジルオキシフェノキシ) -2-トリフルオロメチルフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例150)、

2- {4- [3-クロロ-6- (2-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例151)、

2- {4- [(2R) -2-アミノ-2-フェニルエトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例152)、

2- [4- (2-ビフェニリルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例153)、

2- [4- (3-ビフェニリルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例154)、

2- {4- [2- {(1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル) メトキシ] フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例155)、

2- {4- [3- {(1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル) メトキシ] フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例156)、

2- {4- [3-クロロ-6- (3, 4, 5-トリメトキシフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例157)、

2- {4- [2- (2-ビフェニリル) エトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例158)、

2- [4- (2-ビフェニリルメトキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベ

ンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 159)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-ピペリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 160)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピペリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 161)、

2-{4-[(2R)-2-アセチルアミノ-2-フェニルエトキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 162)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-メチル-3-ペンテニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 163)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-メチル-3-ブテニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 164)、

2-{4-[(2S)-1-ベンジル-2-ピロリジニル] メトキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 165)、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メチルチオフェニル) ベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 166)、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メタンスルホニルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 167)、

2-{4-[3-クロロ-6-(2-チエニル) ベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 168)、

2-{4-[3-クロロ-6-(3-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 169)、

2-{4-[3-クロロ-6-(3-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 170)、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 1

71)、

2-[4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-3-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例172)、

2-[4-(2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例173)、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例174)、

2-{4-[2-{(1-アセチル-4-ピペリジル)メトキシ}フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例175)、

2-{4-[3-{(1-アセチル-4-ピペリジル)メトキシ}フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例176)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(2-プロピニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例177)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-ピリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例178)、

2-(4-ベンジルオキシ-2-メトキシフェニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例179)、

2-[4-(2-ブロモ-5-メトキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例180)、

2-[4-(カルボキシジフェニルメトキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例181)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ニトロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例182)、

2-{4-[3-アセチルアミノ-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実

施例 183)、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 184)、

2- {4- [{(2S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 185)、

2- {2-クロロ-4- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 186)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (2-ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 187)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-フルオロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 188)、

2- {4- [3-カルボキシ-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 189)、

2- {4- [3-カルバモイル-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 190)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 191)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (ピペリジノカルボニルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 192)、

2- {4- [{(2S) -1-ベンゼンスルホニル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 193)、

2- {4- [{(2S) -1-ベンゾイル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェ

ニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 194)、

2 - {4 - [2 - (4 - カルバモイルフェニル) - 5 - クロロベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 195)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 196)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - (ピペリジノカルボニルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 197)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - {(1 - メタンスルホニル - 4 - ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 198)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [{2 - メチル - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - オキサゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 199)、

2 - {4 - [3 - (3 - クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 200)、

2 - {4 - [3 - (4 - クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 201)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [3 - (4 - フルオロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 202)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [{(2S) - 1 - (4 - ニトロフェニル) - 2 - ピロリジニル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 203)、

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [{(2S) - 1 - フェニル - 2 - ピロリジニル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 204)、

2 - {4 - [{(2S) - 1 - (4 - アセチルアミノフェニル) - 2 - ピロリジニル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カ

ルボン酸（実施例 205）、

2- {4- [{5- (4-クロロフェニル) -2-メチル-4-チアゾリル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 206）、

2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 207）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -3-ニトロベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 208）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-テトラヒドロピラニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 209）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 210）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- {(1-メチル-4-ピペリジル) メトキシ] フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 211）、

2- {4- [3- (4-tert-ブチルベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 212）、

2- {4- [3- (2-クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 213）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3-ピリジル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 214）、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 215）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-メトキシフェニル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例 216）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-メタンスルホニルフェニル) -



2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 217)、

2- {4- [{4- (4-クロロフェニル) - 2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 218)、

2- {4- [1- (4-クロロベンジル) - 3-ピペリジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 219)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- {(2-メチル-4-チアゾリル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 220)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- {(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 221)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3, 5-ジクロロフェニル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 222)、

2- {4- [1- (4-クロロベンジル) - 4-ピペリジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 223)、

2- {4- [3- (4-クロロベンジルオキシ) ピペリジノ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 224)、

2- {4- [4-カルバモイル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 225)、

2- {4- [4- (4-クロロベンジルオキシ) ピペリジノ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 226)、

2- {4- [3- {(2-クロロ-4-ピリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 227)、

2- {4- [{(2S) - 1- (4-ジメチルカルバモイルフェニル) - 2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-

5-カルボン酸（実施例228）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-エトキシカルボニルベンジル  
オキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸  
（実施例229）、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェ  
ニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例230）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-ジメチルカルバモイルフェニル)  
-2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5  
-カルボン酸（実施例231）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ジメチルカルバモイルベンジ  
ルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン  
酸（実施例232）、

2- {4- [{4- (4-クロロフェニル) -2-メチル-5-ピリミジニル}  
メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン  
酸 塩酸塩（実施例233）、

2- {4- [{2- (4-クロロフェニル) -3-ピリジル} メトキシ] フェニ  
ル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩（実  
施例234）、

2- {4- [{3- (4-クロロフェニル) -2-ピリジル} メトキシ] フェニ  
ル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例235）、

2- {4- [2- (3-クロロフェニル) -4-メチルアミノ-1, 3, 5-  
トリアジン-6-イルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾ  
ール-5-カルボン酸 トリフルオロ酢酸塩（実施例236）、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (5-テトラゾリル) ベンジ  
ルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン  
酸（実施例237）、

2- [4- (4-ベンジルオキシ-6-ピリミジニルオキシ) フェニル] -1  
-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例238）、

1-シクロヘキシル-2- {4- [4- (4-ピリジルメトキシ) -6-ピリ

ミジニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 2 3 9)、

2- {4- [4- (3-クロロフェニル) -6-ピリミジニルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 2 4 0)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 2 4 1)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 2 4 2)、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-イルメトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (実施例 2 4 3)、

2- [4- (2-ブromo-5-tert-ブトキシカルボニルベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 2 4 4)、

2- {4- [5-tert-ブトキシカルボニル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 2 4 5)、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル 塩酸塩 (実施例 2 4 6)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 2 4 7)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 2 4 8)、

2- {4- [3- (tert-ブチルスルファモイル) -6- (4-クロロフ

ェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 249)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-スルファモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 トリフルオロ酢酸塩 (実施例 250)、

2- (4-ベンジルオキシシクロヘキシル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 251)、

2- [2- (2-ビフェニルオキシメチル) -5-チェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 252)、

2- [2- (2-ビフェニルオキシメチル) -5-フリル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 253)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2-ヒドロキシメチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 254)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-カルボキシフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 255)、

1-シクロヘキシル-2- {2-フルオロ-4- [4-フルオロ-2- (3-フルオロベンゾイル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 256)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸 (実施例 257)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -3-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-4-カルボン酸 (実施例 258)、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3-ジメチルカルバモイル-5- (4-ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 259)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-カルボキシ-5-(4-ピリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 260)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-4-カルボン酸 (実施例 261)、

2-{4-[3-カルバモイル-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 262)、

2-{4-[[2-(4-カルボキシフェニル)-3-ピリジル]メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 263)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-(4-テトラヒドロチオピラニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 264)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 265)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 266)、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-メチルチオフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 267)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチルカルバモイルベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 268)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール

－5－カルボン酸 塩酸塩（実施例269）、

2－{4－[3－カルバモイル－6－（4－クロロフェニル）ベンジルオキシ]  
－2－フルオロフェニル}－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カル  
ボン酸 塩酸塩（実施例270）、

2－{4－[3－ジメチルカルバモイル－6－（4－メタンスルホニルフェニ  
ル）ベンジルオキシ]フェニル}－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5  
－カルボン酸 塩酸塩（実施例271）、

2－{4－[3－ジメチルカルバモイル－6－（3－ピリジル）ベンジルオキ  
シ]フェニル}－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 二  
塩酸塩（実施例272）、

2－{4－[3－ジメチルカルバモイル－6－（4－ジメチルカルバモイルフ  
ェニル）ベンジルオキシ]フェニル}－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール  
－5－カルボン酸（実施例273）、

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]フ  
ェニル}－1－（1－オキソ－4－テトラヒドロチオピラニル）ベンゾイミダゾ  
ール－5－カルボン酸（実施例274）、

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]フ  
ェニル}－1－（1，1－ジオキソ－4－テトラヒドロチオピラニル）ベンゾイ  
ミダゾール－5－カルボン酸（実施例275）、

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]－  
2－フルオロフェニル}－1－（4－テトラヒドロチオピラニル）ベンゾイミダ  
ゾール－5－カルボン酸（実施例276）、

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]－  
2－フルオロフェニル}－1－（1－オキソ－4－テトラヒドロチオピラニル）  
ベンゾイミダゾール－5－カルボン酸（実施例277）、

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]－  
2－フルオロフェニル}－1－（1，1－ジオキソ－4－テトラヒドロチオピラ  
ニル）ベンゾイミダゾール－5－カルボン酸（実施例278）、

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－ジメチルスルファモイルベン

ジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 279)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メタンスルホニルベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 280)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メチルスルファモイルベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 281)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ジメチルアミノベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 282)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メタンスルホニルアミノベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 283)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ジエチルカルバモイルベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 284)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - イソプロピルカルバモイルベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 285)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ピペリジノカルボニルベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 286)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 1 - ピロリジニル ) カルボニルベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 287)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) カルバモイルベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 288)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジノ) カルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例289)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-モルホリノカルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例290)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-チオモルホリノカルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例291)、

2- {4- [3- (カルボキシメチルカルバモイル) -6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例292)、

2- {4- [2- {4- (2-カルボキシエチル) フェニル} -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例293)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-ヒドロキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例294)、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メトキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例295)、

2- {4- [2- (3-カルボキシフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例296)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルチオベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例297)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルスルフィニルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸



(実施例 298)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-シアノベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 299)、

2- {4- [ビス (2-ピリジル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 300)、

2- {4- [ビス (4-ジメチルカルバモイルフェニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 301)、

2- {4- [ビス (2-チエニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 302)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 303)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 ナトリウム塩 (実施例 304)、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 305)、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 306)、

2- {4- [2- (4-カルバモイルフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 307)、

2- {4- [5-アミノ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 308)、

2- {4- [5- (4-クロロフェニル) -2-メトキシベンジルスルフィニ

ル] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 309)、

2 - { 4 - [ 5 - ( 4 - クロロフェニル) - 2 - メトキシベンジルスルホニル] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 310)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル) - 5 - メトキシベンジルチオ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 311)、

2 - { 4 - [ビス ( 4 - カルボキシフェニル) メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 312)、

2 - { 4 - [フェニル - 3 - ピリジルメトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 313)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル) - 5 - (メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル (実施例 314)、

2 - { 4 - [ 5 - クロロ - 2 - ( 4 - ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 315)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル) - 5 - (ベンジルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 316)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル) - 5 - (シクロヘキシルメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 317)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル) - 5 - ( 4 - ピリジルメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 318)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル) - 5 - (N - ベンジル - N - メチル

カルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 1 9)、

2- { 4- [ 5-ジメチルアミノカルボニル-2- (4-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 3 2 0)、

2- { 4- [ 2- (4-クロロフェニル) - 5- (4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 3 2 1)、

2- { 4- [ 2- (4-クロロフェニル) - 5- {N- (3-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 3 2 2)、

2- { 4- [ 2- (4-クロロフェニル) - 5- {N- (2-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 3 2 3)、

2- { 4- [ 2- (4-クロロフェニル) - 5- (シクロヘキシルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 2 4)、

2- { 4- [ 2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-ピリジン-4-イルエチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 3 2 5)、

2- { 4- [(4-フルオロフェニル) { 4- (ジメチルアミノカルボニル) フェニル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 3 2 6)、

2- { 4- [(4-フルオロフェニル) (4-カルボキシフェニル) メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 3 2 7)、

2- { 4- [ 2- (4-クロロフェニル) - 5- (4-オキソピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 2 8)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ヒドロキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例329)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例330)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例331)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (フェニルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例332)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-メトキシピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例333)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3-ヒドロキシプロピルオキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例334)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-ヒドロキシエトキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例335)、

2- [4- (2-ブロモ-5-ニトロベンジルオキシ) -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例336)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5-ニトロベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例337)、

2- [4- {5-アミノ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン

酸メチルエステル (実施例 3 3 8)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 3 3 9)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 4 0)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-メチルピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 4 1)、

2- {4- [5-アセチル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 4 2)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) メトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 3 4 3)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-メトキシエトキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 4 4)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {2- (2-メトキシエトキシ) エトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 4 5)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソブチルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 3 4 6)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-メチルチアゾール-4-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 3 4 7)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3, 4-ジヒドロキシピペ

リジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 348)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 349)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 350)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 351)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 352)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 353)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 354)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(2-ヒドロキシエチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 355)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(4-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 356)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 357)、

2- {4- [5- (2-アミノチアゾール-4-イル) -2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例358)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルスルホニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例359)、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (4-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例360)、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (3-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例361)、

2- {4- [2- (5-クロロチオフエン-2-イル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例362)、

2- {4- [2-プロモ-5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例363)、

2- {4- [2-プロモ-5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例364)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例365)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例366)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- テトラゾール-5-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボ

ン酸 塩酸塩 (実施例 3 6 7)、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-シアノフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 6 8)、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-テトラゾール-5-イルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 6 9)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {2- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) エトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 0)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピペリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 1)、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 2)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-ヒドロキシアミジノ) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 3 7 3)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 4)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 5)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] -2-



フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸  
塩酸塩 (実施例 376)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (シクロプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイ  
ミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 377)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (シクロブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダ  
ゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 378)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (tert - ブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾ  
イミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 379)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (イソブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダ  
ゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 380)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - {(1 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シ  
クロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 381)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (メトキシカルバモイル) ベ  
ンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾ  
ール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 382)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - {(2, 3 - ジヒドロキシプロ  
ピル) カルバモイル} ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロ  
ヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 383)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (N - エチル - N - メチルカ  
ルバモイル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシル  
ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 384)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (N - メチル - N - プロピル  
カルバモイル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシ  
ルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 385)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例386)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2, 6-ジメチルピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例387)、

2- {4- [5- (ブチルカルバモイル) - 2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例388)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (プロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例389)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (エチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例390)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(ジメチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例391)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(モルホリノカルボニル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例392)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- ウレイドベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例393)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(エチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例394)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(イソプロピルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベン

ゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 395)、

2- {4- [2- (3, 4-ジフルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 396)、

2- {4- [2- (2, 4-ジフルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 397)、

2- {4- [2- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 398)、

2- {4- [2- (3-クロロ-4-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 399)、

2- {4- [2- (3, 4-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 400)、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 401)、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 402)、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 403)、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 404)、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} -5- (2-オキソピロリ

ジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 405)、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 406)、

2- {4- [4-クロロ-2- (4-クロロフェニル) - 5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 407)、

2- {4- [4-クロロ-2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 408)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルアミノスルホニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 409)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 410)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 411)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 412)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 413)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カル

ボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 4)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - ヒドロキシピペリジン  
- 1 - イルカルボニル ) ベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロペンチルベン  
ゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 5)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( イソプロピルカルバモイル )  
ベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - ( テトラヒドロチオピラン - 4 - イル ) ベン  
ゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 6)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( ピロリジン - 1 - イルカル  
ボニル ) ベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - ( テトラヒドロチオピラン - 4 - イ  
ル ) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 7)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( イソプロピルカルバモイル )  
ベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - ( テトラヒドロチオピラン -  
4 - イル ) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 8)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - オキソピロリジン - 1  
- イル ) ベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - ( テトラヒドロチオ  
ピラン - 4 - イル ) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1  
9)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( イソプロピルカルバモイル )  
ベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - ピペリジノベンゾイミダゾー  
ル - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 0)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( ピロリジン - 1 - イルカル  
ボニル ) ベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - ピペリジノベンゾイ  
ミダゾール - 5 - カルボン酸 (実施例 4 2 1)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - イミダゾリン - 2 - イ  
ル ) ベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイ  
ミダゾール - 5 - カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 4 2 2)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - オキソオキサゾリジン  
- 3 - イル ) ベンジルオキシ ] - 2 - フルオロフェニル } - 1 - シクロヘキシル  
ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 3)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 4)、

2 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2 - オキサゾリン - 2 - イルアミノ) ベンジルオキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 4 2 5)、

2 - {4 - [{2 - [(ジメチルカルバモイル) メトキシ] メチル} - 4 - (4 - フルオロフェニル) チアゾール - 5 - イル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 6)、

2 - {4 - [{4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イルメチル) チアゾール - 5 - イル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 4 2 7)、

2 - {4 - [{4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - [(カルバモイルメトキシ) メチル] チアゾール - 5 - イル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 8)、

2 - {4 - [{4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - (メチルカルバモイル) チアゾール - 5 - イル} メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 9)、

2 - {4 - [{4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - {(2 - ヒドロキシエチル) カルバモイル} チアゾール - 5 - イル} メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 3 0)、

2 - {4 - [{2 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - (ジメチルカルバモイル) チオフェン - 3 - イル} メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 3 1)、

2 - {4 - [{2 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - (イソプロピルカルバモイル) チオフェン - 3 - イル} メトキシ] - 2 - フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 3 2)、

2 - {4 - [{2 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - (4 - ヒドロキシピペリジ

ン-1-イルカルボニル) チオフェン-3-イル} メトキシ] -2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩(実施例433)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール (実施例434)、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール 塩酸塩 (実施例435)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシル-5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンゾイミダゾール 塩酸塩 (実施例436)、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール (実施例437)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール (実施例438)、

2- {4- [{N- (4-ジメチルカルバモイル) -N- (4-フルオロフェニル) アミノ} メチル] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例439)、

2- {5- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] -2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例440)、

2- {3- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] -2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例441)、

2- {4- [(3-ジメチルカルバモイルフェニル) (4-フルオロフェニル)

メトキシ} - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール  
- 5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 2)、

2 - { 4 - [{ 3 - ( 4-ヒドロキシピペリジル - 1-イルカルボニル) フェニ  
ル} ( 4-フルオロフェニル) メトキシ} - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロ  
ヘキシルベンゾイミダゾール - 5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 3)、

1 - {[ 2 - { 4 - ([ 4 - ( 4-フルオロフェニル) - 2-メチルチアゾール  
- 5-イル] メトキシ) フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール -  
5-イル] カルボニル} -  $\beta$ -D-グルクロン酸 (実施例 4 4 4)、

{[ 2 - { 4 - [ビス ( 3-フルオロフェニル) メトキシ} - 2-フルオロフェ  
ニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5-イル] カルボニル} -  $\beta$   
-D-グルクロン酸 (実施例 4 4 5)、

2 - { 4 - [ 2 - ( 4-クロロフェニル) - 5 - ( 1, 1-ジオキソイソチア  
ゾリジン - 2-イル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロ  
ヘキシルベンゾイミダゾール - 5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 6)、

3 - {[ 4 - ( 5-アミノスルホニル - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール  
- 2-イル) - 3-フルオロフェノキシ] メチル} - 4 - ( 4-クロロフェニル)  
- N-イソプロピルベンズアミド (実施例 4 4 7)、

2 - [ 4 - { 2 - ( 4-クロロフェニル) - 6 - (イソプロピルアミノカルボ  
ニル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾ  
イミダゾール - 5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 8)、

2 - [ 4 - { 2 - ( 4-クロロフェニル) - 4-フルオロ - 5 - ( 1, 1-ジ  
オキソイソチアゾリジン - 2-イル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル]  
- 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4  
4 9)、

2 - [ 4 - { 2 - ( 4-クロロフェニル) - 5 - (イソプロピルアミノカルボ  
ニル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシル - 4 -  
メトキシベンゾイミダゾール - 5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 0)、

2 - [ 4 - { 2 - ( 4-クロロフェニル) - 5 - (N-イソプロピルカルボニ  
ル - N-メチルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シク



ロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 451)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルカルボニルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 452)、

2-[3-{[4-(4-フルオロフェニル)-2-メチルチアゾール-5-イル]メチル}-4-ヒドロキシフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 453)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-4-フルオロ-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 454)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(メチルスルホニルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 455)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-メチル-N-(メチルスルホニル)アミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 456)、

2-[4-{[3-(4-クロロフェニル)-6-(2-オキソピロリジン-1-イル)ピリジン-2-イル]メチルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 457)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(アセチルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 458)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-エチルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 459)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-プロピルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 460)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-エチル-N-(メチル

スルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 461)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- [N- (メチルスルホニル) - N-プロピルアミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 462)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-アセチル-N-メチルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 463)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- [N- (エチルスルホニル) - N-メチルアミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 464)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- [N-エチル-N- (エチルスルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 465)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- [N- (エチルカルボニル) - N-メチルアミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 466)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- [N-エチル-N- (エチルカルボニル) アミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 467)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 468)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-アセチル-N-イソプロピルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 469)、

{[2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} -  $\beta$ -D-グルクロン酸 (実施例 4

70)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルインドール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例501)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸 (実施例502)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -1-シクロペンチル-1H-インドール-5-カルボン酸 (実施例503)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸エチルエステル (実施例601)、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) -3-シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸 (実施例602)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-6-カルボン酸 (実施例701)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩 (実施例702)、及び、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩 (実施例703) からなる群より選ばれる一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(62) 2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-オキソピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例328)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ヒドロキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例329)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 330)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 331)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (フェニルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 332)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-メトキシピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 333)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3-ヒドロキシプロピルオキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 334)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-ヒドロキシエトキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 335)、

2- [4- (2-ブromo-5-ニトロベンジルオキシ) -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 336)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5-ニトロベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 337)、

2- [4- {5-アミノ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 338)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベン

ゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (実施例 339)、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 340)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-メチルピペリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 341)、

2-{4-[5-アセチル-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 342)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-{(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル)メトキシ}ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 343)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-メトキシエトキシ)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 344)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-{2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ}ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 345)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(イソブチルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 346)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-メチルチアゾール-4-イル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 347)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(3,4-ジヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 348)、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(3-メチル-1,2,4-

オキサジアゾール-5-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 349)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 350)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 351)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 352)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 353)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 354)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(2-ヒドロキシエチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 355)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(4-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 356)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 357)、

2- {4- [5- (2-アミノチアゾール-4-イル) -2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 358)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルスルホニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例359)、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (4-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例360)、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (3-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例361)、

2- {4- [2- (5-クロロチオフェン-2-イル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例362)、

2- {4- [2-ブロモ-5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例363)、

2- {4- [2-ブロモ-5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例364)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例365)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例366)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-テトラゾール-5-イルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例367)、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-シアノフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実

施例 3 6 8)、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-テトラゾール-5-イルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 6 9)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {2- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) エトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 0)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピペリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 1)、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 2)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-ヒドロキシアミジノ) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 3 7 3)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 4)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 5)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 3 7 6)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (シクロプロピルカルバモイ



ル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 377)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (シクロブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 378)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (tert-ブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 379)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 380)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(1-ヒドロキシプロパン-2-イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 381)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (メトキシカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 382)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(2, 3-ジヒドロキシプロピル) カルバモイル} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 383)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-エチル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 384)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-メチル-N-プロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 385)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 386)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2, 6-ジメチルピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例387)、

2- {4- [5- (ブチルカルバモイル) - 2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例388)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (プロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例389)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (エチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例390)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(ジメチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例391)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(モルホリノカルボニル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例392)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- ウレイドベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例393)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(エチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例394)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(イソプロピルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例395)、

2- {4- [2- (3, 4-ジフルオロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベ

ンゾイミダゾール-5-カルボン酸（実施例396）、

2- {4- [2- (2, 4-ジフルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例397）、

2- {4- [2- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例398）、

2- {4- [2- (3-クロロ-4-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例399）、

2- {4- [2- (3, 4-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例400）、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例401）、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例402）、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例403）、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例404）、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩（実施例405）、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} -5- (イソプロピルカル

バモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 406)、

2- {4- [4-クロロ-2- (4-クロロフェニル) - 5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 407)、

2- {4- [4-クロロ-2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 408)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルアミノスルホニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 409)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 410)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 411)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 412)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 413)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 414)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロペンチルベン

ゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 5)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1- (テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 6)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1- (テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 7)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- (テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 8)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- (テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 1 9)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- ピペリジノベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 0)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- ピペリジノベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 4 2 1)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-イミダゾリン-2-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例 4 2 2)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソオキサゾリジン-3-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 3)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソイミダゾリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1- シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 2 4)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキサゾリン-2-イルアミノ) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例425)、

2- {4- [{2- [(ジメチルカルバモイル) メトキシ] メチル] -4- (4-フルオロフェニル) チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例426)、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル) チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩 (実施例427)、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2- [(カルバモイルメトキシ) メチル] チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例428)、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2- (メチルカルバモイル) チアゾール-5-イル} メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例429)、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2- {(2-ヒドロキシエチル) カルバモイル} チアゾール-5-イル} メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例430)、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) チオフェン-3-イル} メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例431)、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) チオフェン-3-イル} メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例432)、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) チオフェン-3-イル} メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例433)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール (実施例434)、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール 塩酸塩 (実施例435)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシル-5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンゾイミダゾール 塩酸塩 (実施例436)、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール (実施例437)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール (実施例438)、

2- {4- [{N- (4-ジメチルカルバモイル) -N- (4-フルオロフェニル) アミノ} メチル] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例439)、

2- {5- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] -2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例440)、

2- {3- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] -2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例441)、

2- {4- [(3-ジメチルカルバモイルフェニル) (4-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例442)、

2- {4- [{3- (4-ヒドロキシピペリジル-1-イルカルボニル) フェニル

ル} (4-フルオロフェニル) メトキシ} - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 3)、

1- {[2- {4- ([4- (4-フルオロフェニル) - 2-メチルチアゾール-5-イル] メトキシ) フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} -  $\beta$ -D-グルクロン酸 (実施例 4 4 4)、

{[2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} -  $\beta$ -D-グルクロン酸 (実施例 4 4 5)、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 6)、

3- {[4- (5-アミノスルホニル-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-2-イル) - 3-フルオロフェノキシ] メチル} - 4- (4-クロロフェニル) - N-イソプロピルベンズアミド (実施例 4 4 7)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 6- (イソプロピルアミノカルボニル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 8)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 4-フルオロ-5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 4 9)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルアミノカルボニル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシル-4-メトキシベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 0)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-イソプロピルカルボニル-N-メチルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 1)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルカルボニルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾ



イミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 2)、

2- [3- {[4- (4-フルオロフェニル) -2-メチルチアゾール-5-イル] メチル} -4-ヒドロキシフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (実施例 4 5 3)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -4-フルオロ-5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 4)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (メチルスルホニルアミノ) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 5)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- [N-メチル-N- (メチルスルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 6)、

2- [4- {[3- (4-クロロフェニル) -6- (2-オキソピロリジン-1-イル) ピリジン-2-イル] メチルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 7)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (アセチルアミノ) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 8)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (N-アセチル-N-エチルアミノ) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 5 9)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (N-アセチル-N-プロピルアミノ) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 6 0)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- [N-エチル-N- (メチルスルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 4 6 1)、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- [N- (メチルスルホニル)

－N－プロピルアミノ} ベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩 (実施例462)、

2－[4－{2－(4－クロロフェニル)－5－(N－アセチル－N－メチルアミノ) ベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩 (実施例463)、

2－[4－{2－(4－クロロフェニル)－5－[N－(エチルスルホニル)－N－メチルアミノ] ベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩 (実施例464)、

2－[4－{2－(4－クロロフェニル)－5－[N－エチル－N－(エチルスルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩 (実施例465)、

2－[4－{2－(4－クロロフェニル)－5－[N－(エチルカルボニル)－N－メチルアミノ] ベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩 (実施例466)、

2－[4－{2－(4－クロロフェニル)－5－[N－エチル－N－(エチルカルボニル) アミノ] ベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩 (実施例467)、

2－[4－{2－(4－クロロフェニル)－5－メトキシベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 (実施例468)、

2－[4－{2－(4－クロロフェニル)－5－(N－アセチル－N－イソプロピルアミノ) ベンジルオキシ} －2－フルオロフェニル] －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩 (実施例469)、

{[2－{4－[2－(4－クロロフェニル)－5－(2－オキソピロリジン－1－イル) ベンジルオキシ] －2－フルオロフェニル} －1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－イル] カルボニル} －β－D－グルクロン酸 (実施例470)、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル)－5－(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} －3－シクロヘキシル－3H－イミダゾ [4, 5－

b] ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 702)、及び、

2- { 4- [ 2- ( 4-クロロフェニル) - 5- (ピロリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル } - 3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ[4, 5-b] ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩 (実施例 703) からなる群より選ばれる一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

(63) (29) 乃至 (62) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る医薬組成物。

(64) (1) 乃至 (28) 又は (29) 乃至 (62) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る C 型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤。

(65) (1) 乃至 (28) 又は (29) 乃至 (62) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る抗 C 型肝炎ウイルス剤。

(66) (29) 乃至 (62) のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る C 型肝炎治療剤。

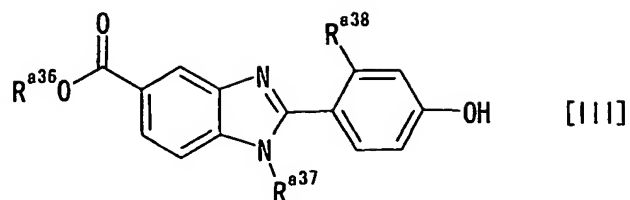
(67) (a) (65) に記載の抗 C 型肝炎ウイルス剤と、(b) 他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも 1 つの薬剤とを組み合わせる抗 C 型肝炎ウイルス剤。

(68) (a) (65) に記載の抗 C 型肝炎ウイルス剤と、(b) インターフェロンとを組み合わせる抗 C 型肝炎ウイルス剤。

(69) (a) (64) に記載の C 型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤と、(b) 他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも 1 つの薬剤とを組み合わせる C 型肝炎治療剤。

(70) (a) (64) に記載の C 型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤と、(b) インターフェロンとを組み合わせる C 型肝炎治療剤。

(71) 下記一般式 [III] で表されるベンゾイミダゾール化合物又はその塩。



(式中、 $R^{a36}$ は水素原子又はカルボン酸保護基であり、 $R^{a37}$ はシクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、 $R^{a38}$ は水素原子又はフッ素原子である。)

(72) 4-(4-フルオロフェニル)-5-ヒドロキシメチル-2-メチルチアゾール及び4-(4-フルオロフェニル)-5-クロロメチル-2-メチルチアゾールからなる群より選ばれるチアゾール化合物又は製薬上許容されるその塩。

(73) 1-(4'-クロロ-2-ヒドロキシメチル-ビフェニル-4-イル)-2-ピロリジノン及び1-(4'-クロロ-2-クロロメチル-ビフェニル-4-イル)-2-ピロリジノンからなる群より選ばれるビフェニル化合物又は製薬上許容されるその塩。

(74) (a)(1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び(b)(1)記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を含有する医薬組成物。

(75) (a)(1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び(b)インターフェロンを含有する医薬組成物。

(76) 有効量の(1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎の治療方法。

(77) 有効量の、(1)記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を投与することをさらに含む、(76)記載の方法。

(78) 有効量のインターフェロン投与することをさらに含む、(76)記載の方法。

(79) 有効量の(1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎ウイルスポリメラーゼの

阻害方法。

(80) 有効量の、(1)記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を投与することをさらに含む、(79)記載の方法。

(81) 有効量のインターフェロン投与することをさらに含む、(79)記載の方法。

(82) C型肝炎治療用医薬を製造するための(1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。

(83) C型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤を製造するための(1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。

(84) (1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎治療用医薬組成物。

(85) (1)記載の一般式[I]で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害用医薬組成物。

(86) (84)記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎の治療用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

(87) (85)記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

本明細書において使用する各置換基及び各部位の定義は、次の通りである。

「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり、好ましくはフッ素原子、塩素原子又は臭素原子である。

特に好ましくは、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$ 、 $R^{6'}$ 、グループA及びグループCにおいてフッ素原子であり、X、Z、Z'、グループB及びグループDにおいてフッ素原子又は塩素原子である。

「C1-6アルキル基」とは、炭素数1乃至6の直鎖又は分岐鎖アルキル基を表し、具体的にはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、

イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、*tert*-ペンチル基、ヘキシル基等が挙げられる。

好ましくは炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖アルキル基であり、特に好ましくは、 $R^{a7}$ 、 $R^{a8}$ 、 $R^{a9}$ 、 $R^{a15}$ 、 $R^{a16}$ 、 $R^{a17}$ 、 $R^{a33}$ 、 $R^{a35}$ 、 $R^{b6}$ 及び $R^{b7}$ においてメチル基であり、 $R^{b1}$ 、 $R^{b2}$ 、グループB及びグループCにおいてメチル基又は*tert*-ブチル基、 $R^{a29}$ においてメチル基、エチル基、プロピル基又はイソプロピル基である。

「ハロゲン化C1-6アルキル基」とは、上記定義の「C1-6アルキル基」が上記定義の「ハロゲン原子」で置換されたものであり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるハロゲン化アルキル基である。具体的には、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ブロモメチル基、クロロメチル基、1, 2-ジクロロメチル基、2, 2-ジクロロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基等が挙げられる。

グループBにおいて特に好ましくは、トリフルオロメチル基である。

「C1-6アルキレン」とは、炭素数1乃至6の直鎖アルキレンを表し、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレンが挙げられる。

Yにおいて好ましくは、メチレン又はエチレンである。

「C2-6アルケニレン」とは、炭素数2乃至6の直鎖アルケニレンを表し、ビニレン、プロペニレン、1-ブテニレン、1, 3-ブタジエニレン等が挙げられる。

Yにおいて好ましくは、ビニレンである。

「C1-6アルコキシ基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6アルキル基」であるアルキル-オキシ基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルコキシ基である。具体的にはメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブチルオキシ基、*tert*-ブチルオキシ基、ペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基等が挙げられる。

$R^{a2}$ 、 $R^{a3}$ 、 $R^{a27}$ 、 $R^{a28}$ 、 $R^{a33}$ 、グループA及びグループCにおいて特に好まし

くは、メトキシ基である。

「C1-6 アルコキシC1-6 アルコキシ基」とは、上記定義の「C1-6 アルコキシ基」が上記定義の「C1-6 アルコキシ基」に置換されたものであり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルキルーオキシアルキルーオキシ基である。具体的にはメトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエトキシ基、メトキシプロポキシ基、イソプロピルオキシエトキシ等が挙げられる。

グループAにおいて特に好ましくは、メトキシエトキシ基である。

「C1-6 アルカノイル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6 アルキル基」であるアルキルーカルボニル基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルカノイル基である。具体的にはアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、ピバロイル基等が挙げられる。

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{a5}$ 、 $R^{a29}$ 、 $R^{b7}$ 、グループBにおいて特に好ましくは、アセチル基である。

「C1-6 アルコキシカルボニル基」とは、そのアルコキシ部位が上記定義の「C1-6 アルコキシ基」であるアルキルーオキシカルボニル基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルコキシカルボニル基である。具体的には、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブチルオキシカルボニル基、tert-ブチルオキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、ヘキシルオキシカルボニル基等が挙げられる。

$R^{a10}$ 及びグループAにおいて特に好ましくは、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基である。

「C1-6 アルキルアミノ基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6 アルキル基」であるアルキルーアミノ基若しくはジアルキルーアミノ基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルキルアミノ基若しくはジアルキルアミノ基である。具体的にはメチルアミノ

基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、N-イソプロピル-N-イソブチルアミノ基等が挙げられる。

R<sup>07</sup>において特に好ましくはメチルアミノ基であり、R<sup>021</sup>及びグループAにおいて特に好ましくはジメチルアミノ基であり、R<sup>024</sup>において特に好ましくはジメチルアミノ基、エチルアミノ基、イソプロピルアミノ基である。

「C1-6 アルカノイルアミノ基」とは、そのアルカノイル部位が上記定義の「C1-6 アルカノイル基」であるアルキル-カルボニル-アミノ基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルキルカルボニルアミノ基である。具体的にはアセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、ピバロイルアミノ基等が挙げられる。

X及びR<sup>010</sup>において特に好ましくは、アセチルアミノ基である。

「C1-6 アルキルスルホニル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6 アルキル基」であるアルキル-スルホニル基であり、好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基であるアルキルスルホニル基である。具体的には、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基等が挙げられる。

X及びR<sup>05</sup>において特に好ましくは、メチルスルホニル基である。

「C6-14 アリール基」とは、炭素数6乃至14の芳香族炭化水素基であり、具体的にはフェニル基、ナフチル基、アントリル基、インデニル基、アズレニル基、フルオレニル基、フェナントリル基等が挙げられる。

環A、環A'、環B及び環B'において、好ましくはフェニル基又はナフチル基、特に好ましくはフェニル基である。

「C3-8 シクロアルキル基」とは、炭素数3乃至8個、好ましくは5乃至7個の飽和シクロアルキル基であり、具体的にはシクロプロピル基、シクロブチル基、



シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基及びシクロオクチル基である。

環A、環A'、環B及び環B' において特に好ましくは、シクロヘキシル基である。

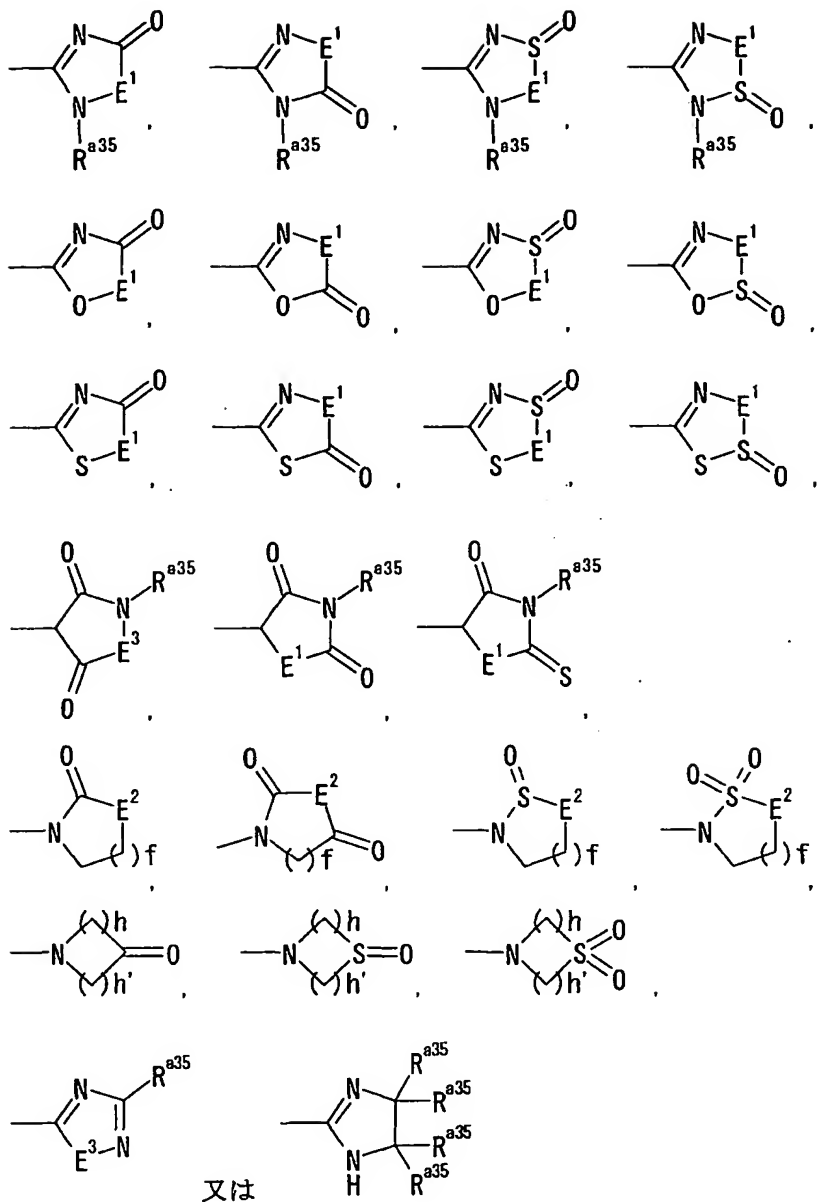
「C3-8 シクロアルケニル基」とは、炭素数3乃至8個、好ましくは5乃至7個のシクロアルケニル基であり、少なくとも1個、好ましくは1又は2個の二重結合を含む。具体的にはシクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキセニル基、2, 4-シクロヘキサジエン-1-イル基、2, 5-シクロヘキサジエン-1-イル基、シクロヘプテニル基及びシクロオクテニル基等が挙げられ、フェニル基の様なアリール基及び完全飽和のシクロアルキル基を含まない。

環A、環A' において好ましくは、シクロヘキセニル基である。

「ヘテロ環基」とは、環を構成する原子として、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有し、環を構成する原子の数が3乃至14であり、飽和環及び不飽和環、単環及び縮合環を含む。

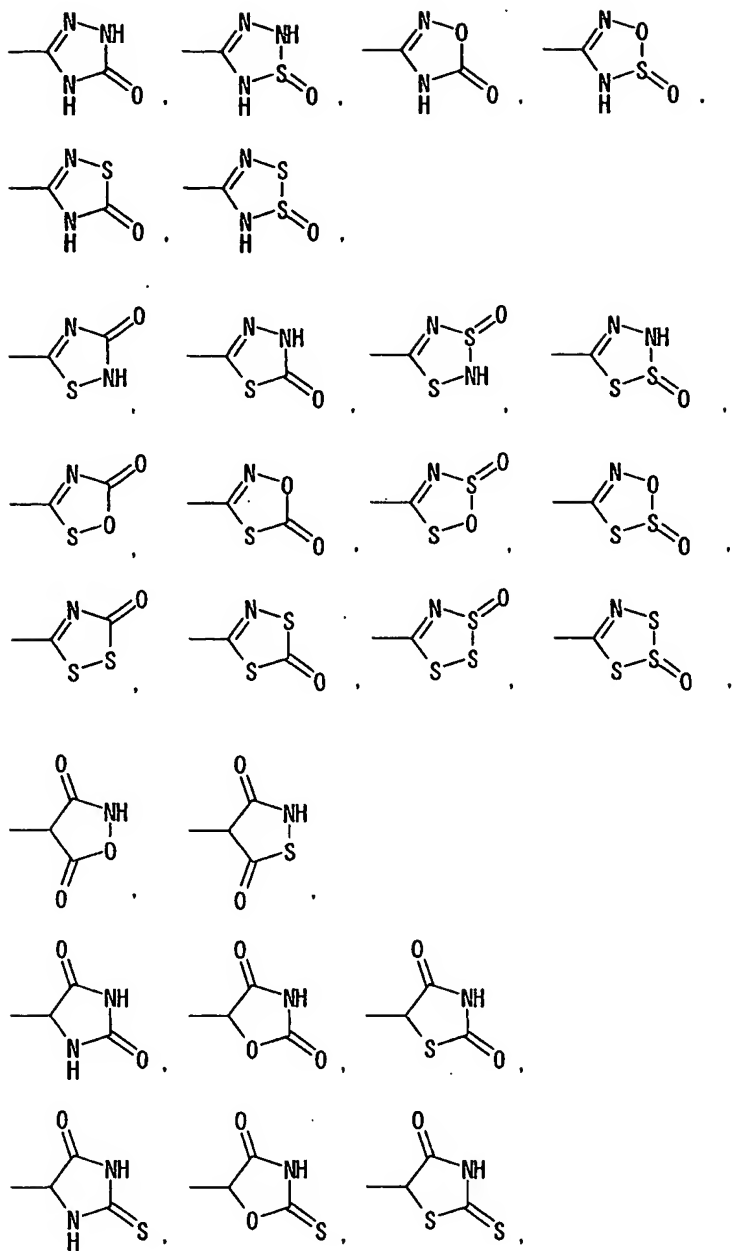
単環であるヘテロ環基として具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリニル基、ピロリジニル基、イミダゾリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基等が挙げられる。

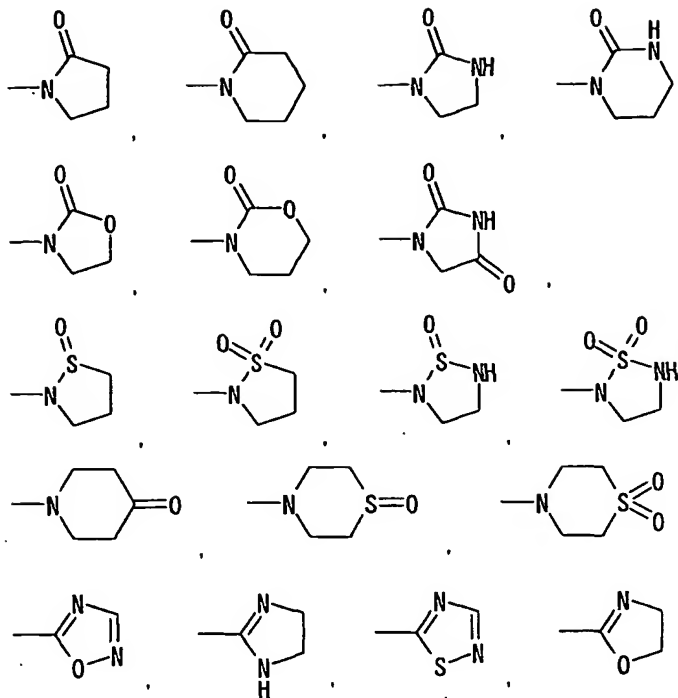
また、当該ヘテロ環には以下式で表される基も含まれる。



(式中、E<sup>1</sup>は酸素原子、硫黄原子又はN(-R<sup>a35</sup>)であり、E<sup>2</sup>は酸素原子、CH<sub>2</sub>又はN(-R<sup>a35</sup>)であり、E<sup>3</sup>は酸素原子又は硫黄原子であり、ここでR<sup>a35</sup>は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基であり、fは1乃至3の整数であり、h及びh'はそれぞれ同一若しくは異なって1乃至3の整数である。)

具体的には、

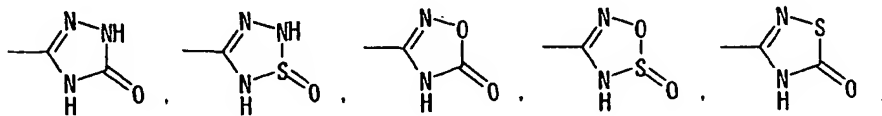


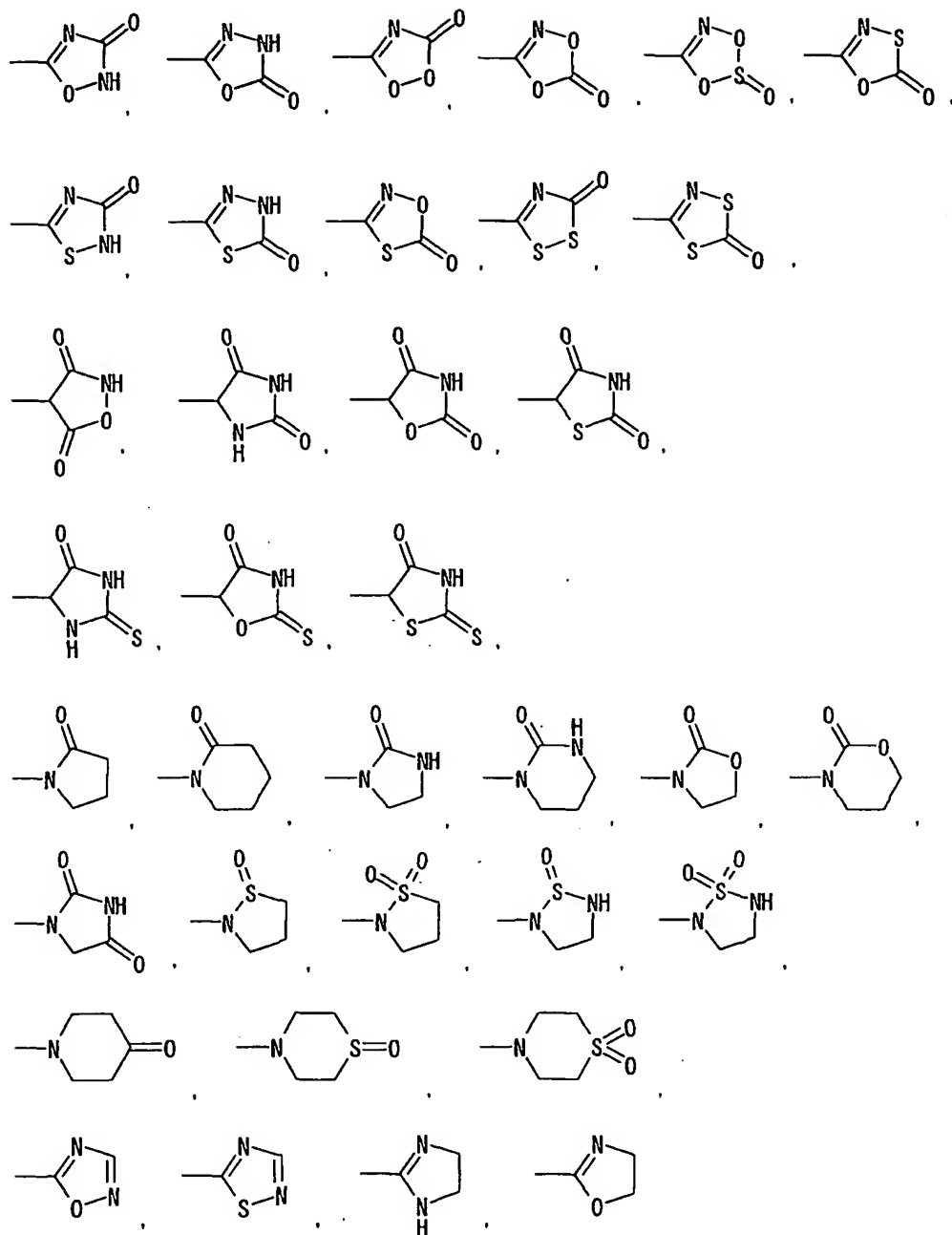


等が挙げられる。

また、縮合環であるヘテロ環基として具体的には、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリル基、キノキサリル基、フタラジニル基、シンノリニル基、ナフチリジニル基、5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、2, 3-ジヒドロベンゾイミダゾリル基、2, 3-ジヒドロ-2-オキソベンゾイミダゾリル基、インドリニル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基等が挙げられる。

好ましくは、5員環或は6員環の単環であるヘテロ環基であり、具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、





等が挙げられる。

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、Z及びグループDにおいて特に好ましくは、テトラゾリル基、5-オキソ- $\Delta^2-1, 2, 4$ -オキサジアゾリン-3-イル基である。

環A及び環A'において特に好ましくは、芳香族であるピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基であり、さらに好ましくはピリジル基で

ある。

環B及び環B'において特に好ましくは、芳香族であるピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、インチアゾリル基、チアジアゾリル基である。更に好ましくはピリジル基、チアゾリル基であり、最も好ましくはチアゾリル基である。

「C6-14 アリールC1-6 アルキル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C1-6 アルキル基」であり、アリール部位が上記定義の「C6-14 アリール基」であるアリール-アルキル基である。好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖のアルキル基であり、アリール部位がフェニル基であるアリール-アルキル基であり、具体的には、ベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基等が挙げられる。

R<sup>a6</sup>及びR<sup>b6</sup>において特に好ましくは、ベンジル基である。

「グルクロン酸残基」とは、グルクロン酸の何れかの水酸基を除いた残りの基であり、好ましくはβ-D-グルクロン酸の1位で置換する基である。

「C6-14 アリールC1-6 アルキルオキシカルボニル基」とは、そのC6-14 アリールC1-6 アルキル部位が上記定義の「C6-14 アリールC1-6 アルキル基」である、アリール-アルキル-オキシカルボニル基である。好ましくはそのアルキル部位が炭素数1乃至4の直鎖のアルキル基であり、アリール部位がフェニル基であるアリール-アルキル-オキシカルボニル基であり、具体的には、ベンジロキシカルボニル基、フェネチロキシカルボニル基、3-フェニルプロピロキシカルボニル基、2-フェニルプロピロキシカルボニル基、4-フェニルブチロキシカルボニル基等が挙げられる。

R<sup>b7</sup>において特に好ましくは、ベンジロキシカルボニル基である。

「置換されてもよいC1-6 アルキル基」とは、上記定義の「C1-6 アルキル基」、好ましくは炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基が1乃至3個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアルキル基を含む。該置換基としては、上記定義の「ハロゲン原子」、水酸基、カルボキシル基、アミノ基、上記定義の「C

1-6 アルコキシ基」、上記定義の「C1-6 アルコキシC1-6 アルコキシ基」、上記定義の「C1-6 アルコキシカルボニル基」及び上記定義の「C1-6 アルキルアミノ基」から選ばれる。「置換されてもよいC1-6 アルキル基」として具体的には、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、*tert*-ペンチル基、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、4-ヒドロキシブチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基、1-ヒドロキシプロパン-2-イル基、1,3-ジヒドロキシプロパン-2-イル基、1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル基、カルボキシルメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシメチル基、メトキシエチル基、メトキシエトキシエチル基、エトキシカルボニルメチル基、2-エトキシカルボニルエチル基、2-ジメチルアミノエチル基等が挙げられる。

好ましくは、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  においてメチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル、カルボキシルメチル基又は2-ジメチルアミノエチル基であり、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  及び  $R^{6'}$  においてはメチル基又はトリフルオロメチル基であり、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^{a31}$  及び  $R^{b5}$  においてはメチル基であり、 $R^{a24}$  においてはメチル基、エチル基又はイソプロピル基であり、 $R^{a18}$  においてはメチル基及びイソプロピル基であり、 $R^{a1}$ 、 $R^{a19}$  及び  $R^{a25}$  においてはメチル基又はエチル基、 $R^{a2}$  及び  $R^{a3}$  においてはメチル基、カルボキシルメチル基又は2-ジメチルアミノエチル基であり、 $R^{a6}$  においてはメチル基又はカルボキシルメチル基であり、Xにおいてはメチル基、エチル基、イソプロピル基、ブチル基又はトリフルオロメチル基であり、 $R^{a10}$  においては、メチル基、エチル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*tert*-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基又はカルボキシルメチル基であり、 $R^{a11}$  においてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、トリフルオロメチル基、2-ヒドロキシエチル基又はカルボキシルメチル基であり、 $R^{a12}$  においてはメチル基又は4-ヒドロキシブチル基であり、 $R^{a13}$  においてはメチル基、エチル基、イソプロピル基、ブチル基、2-ヒドロキシエチル基、4-ヒドロキシブチル基、エ

トキシカルボニルメチル基、2-（エトキシカルボニル）エチル基又は2-ジメチルアミノエチル基であり、 $R^{*20}$ においてはメチル基、プロピル基、ブチル基、イソペンチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、メトキシエチル基、メトキシエトキシエチル基、又はカルボキシメチル基であり、 $R^{*22}$ 及び $R^{*23}$ においてはメチル基、エチル基であり、 $R^{*26}$ においてはメチル基、イソプロピル基又はtert-ブチル基であり、 $R^{*27}$ 及び $R^{*28}$ においてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、イソブチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロパン-2-イル基、1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル基又はカルボキシルメチル基であり、Z、Z' 及びグループDにおいてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシメチル基又はエトキシカルボニルメチル基である。

特に好ましくは、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$ 及び $R^{6'}$ においてはトリフルオロメチル基であり、 $R^{*26}$ においてはメチル基又はtert-ブチル基であり、Z、Z' 及びグループDにおいてはメチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基又はヒドロキシメチル基であり、その他各置換基においてはメチル基である。

「置換されてもよいC2-6アルケニル基」とは、炭素数2乃至6の直鎖又は分岐鎖アルケニル基が1乃至3個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアルケニル基を含む。該置換基としては、上記定義の「ハロゲン原子」、水酸基、カルボキシル基、アミノ基、上記定義の「C1-6アルコキシ基」、上記定義の「C1-6アルコキシC1-6アルコキシ基」、上記定義の「C1-6アルコキシカルボニル基」及び上記定義の「C1-6アルキルアミノ基」から選ばれる。「置換されてもよいC2-6アルケニル」として具体的には、ビニル基、アリル基、1-プロペニル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1,3-ブタジエニル基、2-イソペンテニル基、3-イソヘキセニル基、4-メチル-3-ペンテニル基、2-カルボキシルエテニル基等が挙げられる。

Xにおいて好ましくは2-カルボキシルエテニル基であり、 $R^{*20}$ において好ましくは、2-イソペンテニル基、3-イソヘキセニル基又は4-メチル-3-ペ



ンテニル基である。

「置換されてもよいC2-6アルキニル基」とは、炭素数2乃至6の直鎖又は分岐鎖アルキニル基が1乃至3個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアルキニル基を含む。該置換基としては、上記定義の「ハロゲン原子」、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、上記定義の「C1-6アルコキシ基」、上記定義の「C1-6アルコキシカルボニル基」及び上記定義の「C1-6アルキルアミノ基」から選ばれる。具体的にはエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

$R^{a20}$  において好ましくは、2-プロピニル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」とは、上記定義の「C6-14アリール基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアリール基を含む。該置換基は、上記定義の「ハロゲン原子」、シアノ基、ニトロ基、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$  及び  $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$  (ここで $R^{b1}$ 及び $R^{b2}$ は、それぞれ独立して、水素原子又は上記定義の「C1-6アルキル基」であり、 $r$ は0又は1乃至6の整数である。) から選ばれる。

具体的にはフェニル基、ナフチル基、アントリル基、インデニル基、アズレニル基、フルオレニル基、フェナントリル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-アセチルフェニル基、4-カルボキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-アミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、4-(メチルスルホニルアミノ)フェニル基、4-メトキシフェニル基、3,4,5-トリメトキシフェニル基、4-

メチルチオフェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、4-アミノスルホニルフェニル基、3-ニトロ-4-メトキシフェニル基、4-ニトロ-3-メトキシフェニル基が挙げられる。

アリール部位において好ましくはフェニル基であり、グループBとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ であり、具体的にはフッ素原子、塩素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基又はメトキシ基である。特に好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」として好ましくは、 $R^{a12}$ 、 $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ においてはフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-メトキシフェニル基又は4-トリフルオロメチルフェニル基であり、 $R^{a14}$ 、 $R^{a22}$ 、 $R^{a23}$ 、 $R^{a26}$ 及び $R^{b5}$ においてフェニル基、 $R^{a18}$ においてはフェニル基、3-フルオロフェニル基、 $R^{a20}$ においてはフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、 $R^{a24}$ においてはフェニル基、4-クロロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、3-ニトロ-4-メトキシフェニル基又は4-ニトロ-3-メトキシフェニル基、 $R^{a25}$ においてはフェニル基又は4-メチルフェニル基である。

各置換基において特に好ましくは、フェニル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」とは、上記定義の「C6-14アリール基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアリール基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(q)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、アセチル基、カルボキシ基、メトキシカルボニ

ル基、エトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル基、(カルボキシルメチル)アミノカルボニル基、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、イソペンチルオキシ基、2-イソペンテニルオキシ基、3-イソヘキセニルオキシ基、4-メチル-3-ペンテニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、ヒドロキシメチルオキシ基、カルボキシルメチルオキシ基、(ジメチルアミノカルボニル)メチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、テトラゾリル基が挙げられる。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」として具体的には、フェニル基、ナフチル基、アントリル基、インデニル基、アズレニル基、フルオレニル基、フェナントリル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ニトロフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-(ヒドロキシメチル)フェニル基、4-(メトキシメチル)フェニル基、4-(2-カルボキシルエチル)フェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3,4,5-トリメトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、4-シアノフェニル基、4-アセチルフェニル基、4-アミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-(メチルスルホニルアミノ)フェニル基、4-メチルスルフィニルフェニル基、4-アミノスルホニルフェニル基、3-ニトロ-4-メトキシフェニル基又は4-ニトロ-3-メトキシフェニル基、4-テトラゾール-5

－イルフェニル基が挙げられる。

Z 及び Z' において、アリール部位として好ましくはフェニル基である。

グループ D として好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよい C1-6 アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$  又は  $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$  である。

特に好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「置換されてもよい C1-6 アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$  又は  $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$  であり、具体的にはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基、アセチルアミノ基である。更に好ましくはフッ素原子、塩素原子、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基であり、最も好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

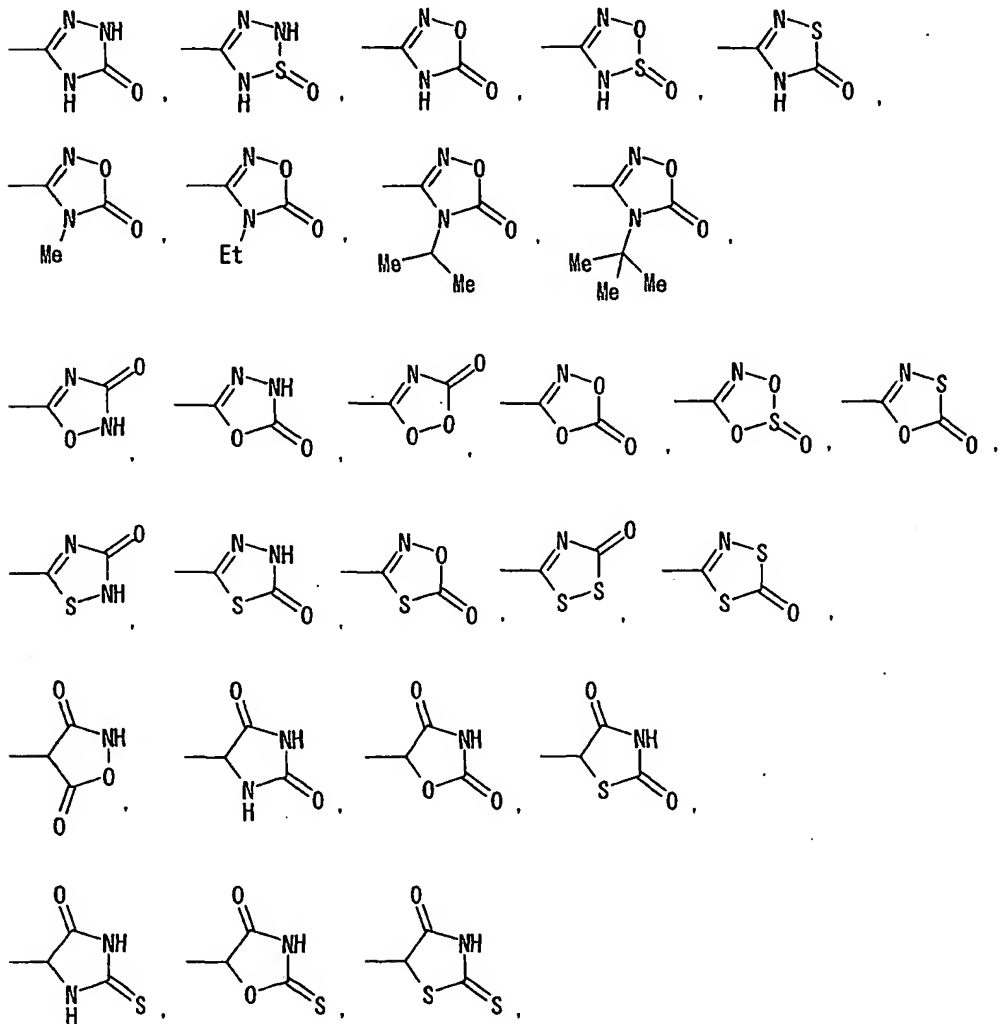
「グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基」として具体的に好ましくは、フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-(ヒドロキシメチル)フェニル基、4-(メトキシメチル)フェニル基、4-(2-カルボキシルエチル)フェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、4-メチルスルフィニルフェニル基、4-アミノスルホニルフェニル基、4-シ

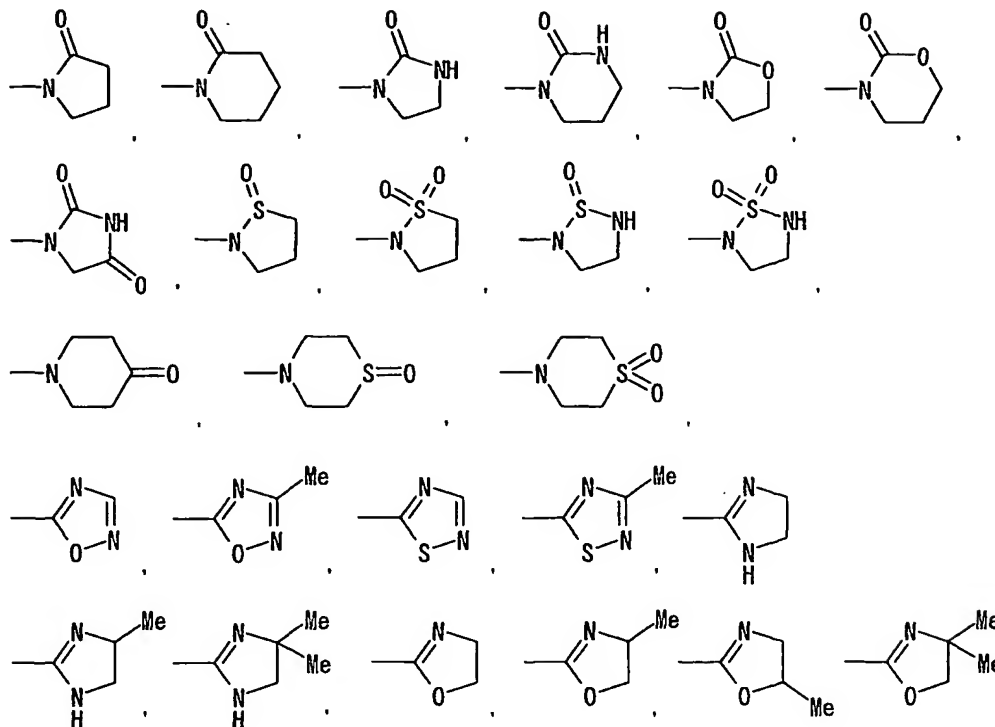
アノフェニル基、4-テトラゾリルフェニル基であり、特に好ましくは、4-クロロフェニル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」とは、上記定義の「ヘテロ環基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環基を含む。該置換基は、上記定義の「ハロゲン原子」、シアノ基、ニトロ基、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-CO R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$  及び  $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$  (ここで $R^{b1}$ 及び $R^{b2}$ は、それぞれ独立して、水素原子又は上記定義の「C1-6アルキル基」であり、 $r$ は0又は1乃至6の整数である。) から選ばれる。

具体的には、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-フルオロピリジン-4-イル基、3-クロロピリジン-4-イル基、4-クロロピリジン-3-イル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、2-メチルオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、2, 5-ジメチルチアゾール-4-イル基、2, 4-ジメチルチアゾール-5-イル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリニル基、ピロリジニル基、3-ヒドロキシピロリジニル基、イミダゾリジニル基、アゼチジニル基、ピペリジル基、3-ヒドロキシピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、3, 4-ジヒドロキシピペリジノ基、4-メトキシピペリジノ基、4-カルボキシピペリジノ基、4-(ヒドロキシメチル)ピペリジノ基、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジノ基、2, 2, 6, 6-テトラメチル-4-ヒドロキシピペリジノ基、N-メチルピペリジン-4-イル基、N-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イル基、N-アセチルピペリジン-4-イル基、N-メチルスルホニルピペリジン-4-イル基、ピペラジニル基、4-メチルピペラジニル基、4-メチルスルホニルピペラ

ジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、1-オキシチオモルホリン-4-イル基、1,1-ジオキシチオモルホリン-4-イル基、テトラヒドロピラニル基、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリニル基、キノキサリル基、フタラジニル基、シンノリニル基、ナフチリジニル基、5,6,7,8-テトラヒドロキノリル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、インドリニル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、



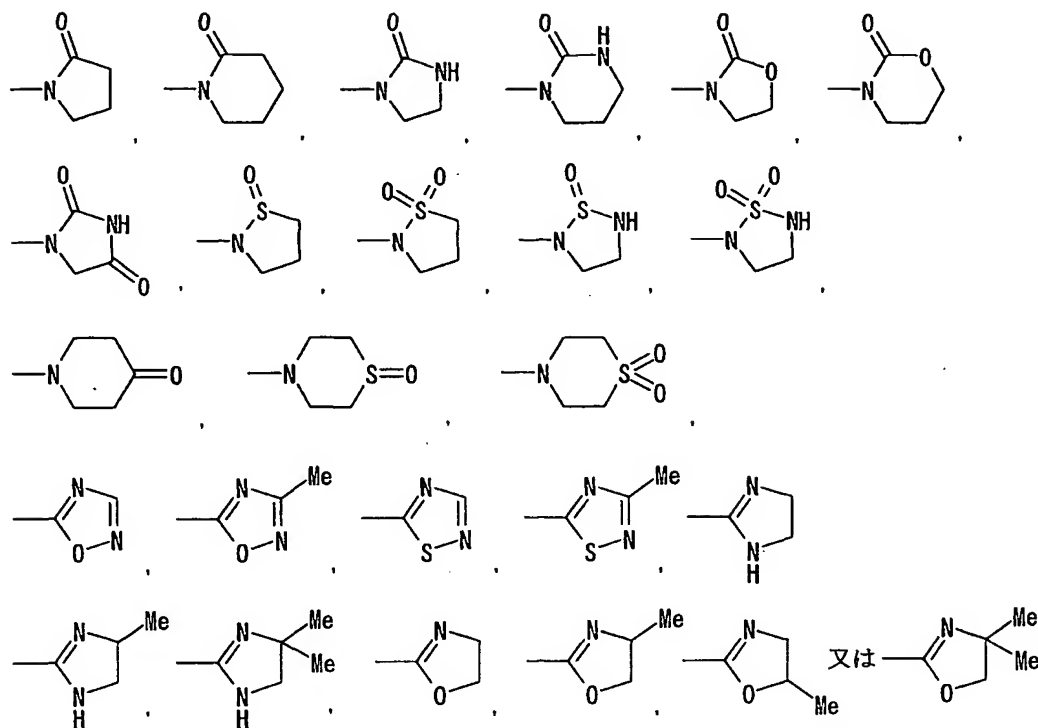


等が挙げられる。

ヘテロ環部位として好ましくは、5員環或は6員環の単環であるヘテロ環基であり、具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基又はテトラヒドロピラニル基であり、グループBとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」として、好ましくはピペリジノ基、4-メチルピペリジノ基、2, 6-ジメチルピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、1-ピペラジニル基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル基、1-ピロリジニル基、モル

ホリノ基、4-チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基、ピリジル基、チアゾリル基、



である。

特に好ましくは、 $R^{a18}$ においてピペリジノ基、4-メチルピペリジノ基、2,6-ジメチルピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、1-ピペラジニル基、1-ピロリジニル基、モルホリノ基、4-チオモルホリニル基であり、 $R^{a20}$ においてはテトラヒドロピラニル基又は4-ヒドロキシピペリジノ基、であり、 $R^{a21}$ においてはピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基又は3,4-ジヒドロキシピペリジノ基であり、 $R^{a24}$ においてはピリジル基又はモルホリノ基であり、 $R^{a25}$ においてはピリジル基又は4-ヒドロキシピペリジノ基であり、 $R^{a26}$ においてはピリジル基又はチアゾリル基であり、 $R^{a27}$ 又は $R^{a28}$ においては1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル基、3-ヒドロキシピロリジニル基、3-ヒドロキシピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、3,4-ジヒドロキシピペリジノ基、4-メトキシピペリジノ基、4-カルボキシピペリジノ基、4-(ヒドロキシメチル)ピペリジノ基、2-オキソピペリジノ基、4-オキソピペリジ

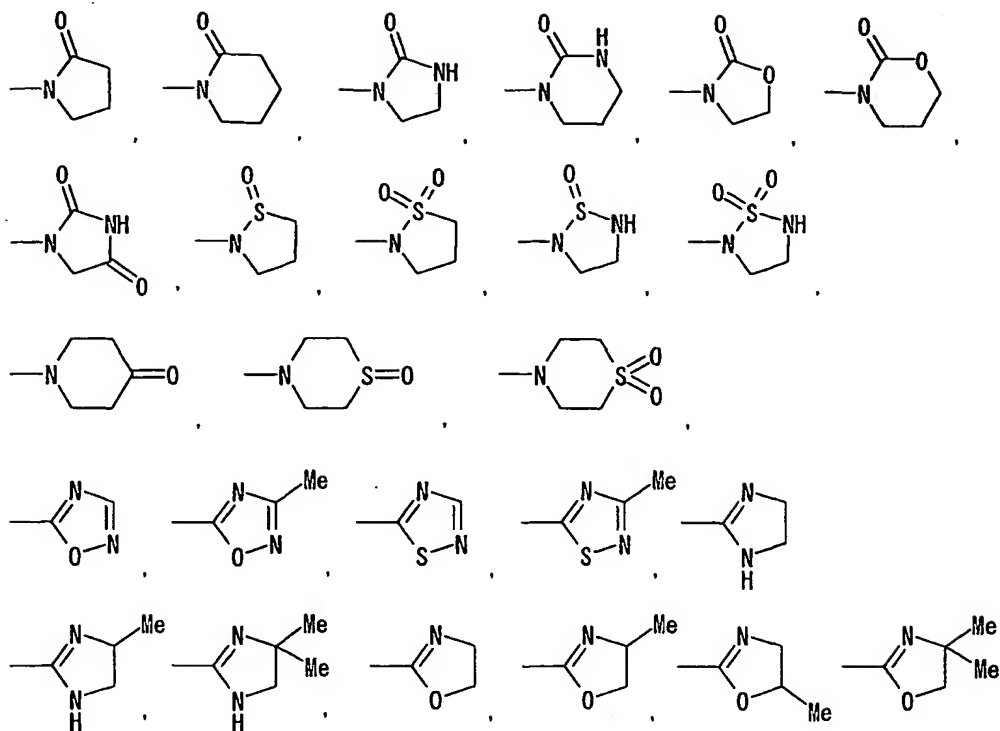


ノ基、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジノ基、2, 2, 6, 6-テトラメチル-4-ヒドロキシピペリジノ基、4-メチルスルホニルピペラジニル基、1-オキシチオモルホリン-4-イル基又は1, 1-ジオキシチオモルホリン-4-イル基であり、R<sup>22</sup>及びR<sup>23</sup>においては2-オキサゾリン-2-イル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」とは、上記定義の「ヘテロ環基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(q)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」で挙げられた置換基が挙げられる。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」として具体的には、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-フルオロピリジン-4-イル基、3-クロロピリジン-4-イル基、4-クロロピリジン-3-イル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、2-メチルオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、2, 5-ジメチルチアゾール-4-イル基、2, 4-ジメチルチアゾール-5-イル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリニル基、ピロリジニル基、イミダゾリジニル基、ピペリジル基、N-メチルピペリジン-4-イル基、N-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イル基、N-アセチルピペリジン-4-イル基、N-メチルスルホニルピペリジン-4-イル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリニル基、キノキサリル基、フタラジニル基、シノリニル基、ナフチリジニル基、5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、インドリニル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、



等が挙げられる。

また、2-ピリジル基の3, 4, 5又は6位、3-ピリジル基の2, 4, 5又は6位、4-ピリジル基の2, 3, 5又は6位、2-チエニル基の3, 4又は5位、3-チエニル基の2, 4又は5位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基、アミノ基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

Z及びZ'において、ヘテロ環部位として好ましくは、5員環或は6員環、単環であるヘテロ環基であり、具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、2-オキソピロリジニル基、2-オキソピペリジニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、2-イミダゾリニル基、2-オキソイミダゾリジニル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、2-オキサゾリニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、1, 1-

ジオキソイソチアゾリジニル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基、 $\Delta^2-1, 2, 4$ -オキサジアゾリル基、5-オキソ- $\Delta^2-1, 2, 4$ -オキサジアゾリル基、5-オキソ- $\Delta^2-1, 2, 4$ -チアジアゾリニル基、2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリニル基であり、グループDとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ である。

具体的な「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」として好ましくは、ピペリジノ基、4-ヒドロキシピペリジノ基、2-オキソピペリジン-1-イル基、1-ピペラジニル基、1-ピロリジニル基、2-オキソピロリジン-1-イル基、モルホリノ基、4-チオモルホリニル基、4-テトラヒドロピラニル基、3-ピリジル基、2-ピリミジニル基、2-イミダゾリン-2-イル基、2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-オキソオキサゾリジン-1-イル基、5-テトラゾリル基、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、5-メチルチアゾール-2-イル基、2-アミノチアゾール-4-イル基、3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル基、1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル基、4, 4-ジメチル- $\Delta^2$ -オキサゾリン-2-イル基、2-チエニル基、5-クロロチオフェン-2-イル基、5-メチルオキサゾール-2-イル基、5-オキソ- $\Delta^2-1, 2, 4$ -オキサジアゾリン-3-イル基、5-オキソ- $\Delta^2-1, 2, 4$ -チアジアゾリン-3-イル基、2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリン-4-イル基である。

特に好ましくは、ピリジル基、ピリミジニル基、テトラゾリル基、チエニル基、ピペリジル基、2-オキソピペリジン-1-イル基、2-オキソピロリジン-1-イル基、2-イミダゾリン-2-イル基、2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-オキソオキサゾリジン-1-イル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、5-メチルチアゾール-2-イル基、2-アミノチアゾール-4-イル基、

3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル基、1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル基、4, 4-ジメチル- $\Delta^2$ -オキサゾリン-2-イル基、5-クロチオフェン-2-イル基、5-メチルオキサゾール-2-イル基、5-オキソ- $\Delta^2$ -1, 2, 4-オキサジアゾリン-3-イル基、5-オキソ- $\Delta^2$ -1, 2, 4-チアジアゾリン-3-イル基、2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリン-4-イル基であり、更に好ましくは2-オキソピペリジン-1-イル基、2-オキソピロリジン-1-イル基、2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-オキソオキサゾリジン-1-イル基及び1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル基であり、最も好ましくは2-オキソピロリジン-1-イル基である。

「グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキル基」が、水酸基、上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルコキシ基」から選ばれる置換基により1乃至5置換されてもよいものであり、無置換であってもよい。具体的には、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、4-フルオロシクロヘキシル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4, 4-ジメチルシクロヘキシル基、3, 5-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

シクロアルキル基部位において好ましくは、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、特に好ましくはシクロヘキシル基である。

環Cy及び環Cy'において好ましくは、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、4-フルオロシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4, 4-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基であり、特に好ましくはシクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、更に好ましくはシクロヘキシル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のシクロアルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的には、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、4-フルオロシクロヘキシル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4, 4-ジメチルシクロヘキシル基、3, 5-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

また、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

シクロアルキル基部位において好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」として、R<sup>27</sup>及びR<sup>28</sup>において特に好ましくはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロヘキシル基又は4-ヒドロキシシクロヘキシル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のシクロアルキル基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(q)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」で挙げられた置換基が挙げられる。

具体的には、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、4-フルオロシクロヘキシル基、2-メチルシ

クロペンチル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、3,5-ジメチルシクロヘキシル基、4-tert-ブチルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

また、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

シクロアルキル基部位において好ましくは、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、Z及びZ'において特に好ましくはシクロヘキシル基である。

「置換されてもよいC3-8シクロアルケニル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルケニル基」が、水酸基、上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルコキシ基」から選ばれる置換基により置換されてもよいものであり、無置換であってもよい。具体的には、シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキセニル基、4-フルオロ-2-シクロヘキセニル基、4-メチル-2-シクロヘキセニル基、4-メチル-3-シクロヘキセニル基、2,4-シクロヘキサジエン-1-イル基、2,5-シクロヘキサジエン-1-イル基、シクロヘプテニル基及びシクロオクテニル基等が挙げられ、フェニル基の様なアリール基及び完全飽和のシクロアルキル基を含まない。

環Cyにおいて、特に好ましくはシクロヘキセニル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」とは、上記定義の「C6-14アリールC1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアリールアルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的にはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フルオロベ

ンジル基、4-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、ペンタフルオロベンジル基、4-メチルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-ニトロベンジル基、4-シアノベンジル基、4-アセチルベンジル基、4-カルボキシルベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、4-アミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、4-アセチルアミノベンジル基、4-(メチルスルホニルアミノ)ベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4, 5-トリメトキシベンジル基、4-メチルチオベンジル基、4-メチルスルホニルベンジル基、4-アミノスルホニルベンジル基、3-ニトロ-4-メトキシベンジル基、4-ニトロ-3-メトキシベンジル基が挙げられる。

C6-14 アリールC1-6 アルキル部位において好ましくはベンジル基、フェネチル基であり、特に好ましくはベンジル基である。グループBとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「C1-6 アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6 アルキル基」、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ であり、具体的にはフッ素原子、塩素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基又はトリフルオロメチルオキシ基である。特に好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基」として、 $R^{a12}$  及び  $R^{a13}$  において好ましくはベンジル基、フェネチル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基又は3-トリフルオロメチルベンジル基、 $R^{a1}$ 、 $R^{a19}$ 、 $R^{a27}$ 、 $R^{a28}$ 、 $R^{a31}$ 、 $R^{b5}$  において好ましくはベンジル基であり、 $R^{a20}$  において好ましくはベンジル基、フェネチル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基又は4-トリフルオロメチルベンジル基であり、 $R^{a22}$  及び  $R^{a23}$  において4-クロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基又は4-トリフルオロメチルベンジル基である。

各置換基において特に好ましくは、ベンジル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」とは、上記定義の「C6-14アリールC1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のアリール基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(q)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、アセチル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル基、(カルボキシメチル) アミノカルボニル基、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、イソプロピルオキシ基、ヒドロキシメチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、(ジメチルアミノカルボニル) メチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホン基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基が挙げられる。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」として具体的にはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ニトロベンジル基、ペンタフルオロベンジル基、4-メチルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-(ヒドロキシメチル) ベンジル基、4-(メトキシメチル) ベンジル基、4-(2-カルボキシエチル) ベンジル基、3-カルボキシベンジル基、4-カルボキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4, 5-トリメトキシベンジル



基、4-カルバモイルベンジル基、4-メチルチオベンジル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)ベンジル基、4-メチルスルホニルベンジル基、4-(アセチルアミノ)ベンジル基、4-シアノベンジル基、4-アセチルベンジル基、4-アミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、4-(メチルスルホニルアミノ)ベンジル基、4-メチルスルフィニルベンジル基、4-アミノスルホニルベンジル基、(3-ニトロ-4-メトキシフェニル)メチル基又は(4-ニトロ-3-メトキシフェニル)メチル基が挙げられる。

Z及びZ'において、C6-14アリールC1-6アルキル部位として好ましくはベンジル基又はフェネチル基であり、グループDとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基」として具体的に好ましくは、ベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ニトロベンジル基、4-メチルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-(ヒドロキシメチル)ベンジル基、4-(メトキシメチル)ベンジル基、4-(2-カルボキシルエチル)ベンジル基、3-カルボキシルベンジル基、4-カルボキシルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3,4,5-トリメトキシベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、4-メチルチオベンジル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)ベンジル基、4-メチルスルホニルベンジル基、4-アセチルアミノベンジル基、4-メチルスルフィニルベンジル基、4-アミノスルホニルベンジル基である。

特に好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 又は $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ であり、具体的にはフッ素原子、

塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、*tert*-ブチル基、カルボキシル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシルエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基、アセチルアミノ基である。更に好ましくはフッ素原子、塩素原子、メチル基、*tert*-ブチル基、カルボキシル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基又はメチルスルホニル基であり、最も好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基」とは、上記定義の「ヘテロ環C1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環C1-6アルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的には、2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、2-クロロピリジン-4-イルメチル基、4-ピリジルメチル基、ピロリルメチル基、イミダゾリルメチル基、2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-フリルメチル基、2-オキサゾリルメチル基、5-イソチアゾリルメチル基、2-メチルオキサゾール-4-イルメチル基、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、2-メチルチアゾール-4-イルメチル基、2-メチルチアゾール-5-イルメチル基、2,5-ジメチルチアゾール-4-イルメチル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基、2,4-ジメチルチアゾール-5-イルメチル基、2-イソチアゾリルメチル基、2-ピロリニルメチル基、ピロリジニルメチル基、ピペリジルメチル基、4-ピペリジルメチル基、1-メチルピペリジン-4-イルメチル基、4-ヒドロキシピペリジノメチル基、3-ヒドロキシピロリジニルメチル基、2-(4-ヒドロキシピペリジノ)エチル基、1-(*tert*-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イルメチル基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチル基、1-メチルスルホニルピペリジン-4-イルメチル基、ピペラジニルメチル基、モルホリノメチル基、チオモルホリニルメチル基、1-テトラヒドロピラニルメチル基、2-キノリルメチル基、1-イソキノリルメチル基等が挙げられる。

ヘテロ環部位として好ましくは、5員環或は6員環、単環であるヘテロ環基で

あり、具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基又はテトラヒドロピラニル基であり、アルキル部位として好ましくは炭素数1乃至4の直鎖のアルキル基である。また、グループBとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、上記定義の「C1-6アルキル基」、上記定義の「ハロゲン化C1-6アルキル基」、上記定義の「C1-6アルカノイル基」、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 又は $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ である。

具体的な「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基」として好ましくは、2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、2-クロロピリジン-4-イルメチル基、4-ピリジルメチル基、ピペリジン-4-イルメチル基、1-メチルピペリジン-4-イルメチル基、2-(4-ヒドロキシピペリジノ)エチル基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチル基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イルメチル基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イルメチル基、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、2-メチルチアゾリン-4-イルメチル基、2, 4-ジメチルチアゾリン-5-イルメチル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基である。特に好ましくは、 $R^{a20}$ において2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、2-クロロピリジン-4-イルメチル基、4-ピリジルメチル基、ピペリジン-4-イルメチル基、1-メチルピペリジン-4-イルメチル基、2-(4-ヒドロキシピペリジノ)エチル基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチル基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イルメチル基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イルメチル基、2-メチルチアゾリン-4-イルメチル基、2, 4-ジメチルチアゾリン-5-イルメチル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基であり、 $R^{a22}$ 及び $R^{a23}$ においては2-ピリジルメチル基、 $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ においては4-ピリジルメチル基及び4-メチルチアゾール-2-イルメチル基である。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基」とは、上記定義の「ヘテロ環C1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環C1-6アルキル基を含む。該置換基は、上記グループD ((a)乃至(q)に示される置換基) から選ばれる。

グループDとして具体的には、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、アセチル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル基、(カルボキシメチル) アミノカルボニル基、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、イソプロピルオキシ基、ヒドロキシメチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、(ジメチルアミノカルボニル) メチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基が挙げられる。

「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基」として具体的には、2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、2-クロロピリジン-4-イルメチル基、4-ピリジルメチル基、ピロリルメチル基、イミダゾリルメチル基、2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-フリルメチル基、2-オキサゾリルメチル基、5-イソチアゾリルメチル基、2-メチルオキサゾール-4-イルメチル基、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、2-メチルチアゾール-4-イルメチル基、2-メチルチアゾール-5-イルメチル基、2, 5-ジメチルチアゾール-4-イルメチル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基、2, 4-ジメチルチアゾール-5-イルメチル基、2-イソチアゾリルメチル基、2-ピロリニルメチル基、ピロリジニルメチル基、ピペリジルメチル基、4-ピペ

リジルメチル基、1-メチルピペリジン-4-イルメチル基、4-ヒドロキシピペリジノメチル基、2-(4-ヒドロキシピペリジノ)エチル基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イルメチル基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチル基、1-メチルスルホニルピペリジン-4-イルメチル基、ピペラジニルメチル基、モルホリノメチル基、チオモルホリニルメチル基、1-テトラヒドロピラニルメチル基、2-キノリルメチル基、1-イソキノリルメチル基等が挙げられる。

Z及びZ'において、ヘテロ環部位として好ましくは、5員環或は6員環、単環であるヘテロ環基であり、具体的には、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、チオモルホリニル基又はテトラヒドロピラニル基であり、アルキル部位として好ましくは炭素数1乃至4の直鎖のアルキル基、特にメチル基(すなわちメチレン)である。

グループDとして好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ である。

具体的な「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基」として好ましくは、2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、2-クロロピリジン-4-イルメチル基、4-ピリジルメチル基、ピペリジン-4-イルメチル基、1-メチルピペリジン-4-イルメチル基、4-ヒドロキシピペリジノメチル基、2-(4-ヒドロキシピペリジノ)エチル基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチル基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イルメチル基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イルメチル基、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、2-メチルチアゾリン-4-イルメチル基、2, 4-ジメチルチアゾリン-5-イルメ

チル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチル基である。

特に好ましくは、4-ヒドロキシピペリジノメチル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基」とは、上記定義の「C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のシクロアルキル基を含む。該置換基は、上記グループBから選ばれる。

具体的には、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-(シクロペンチル)エチル基、2-(シクロヘキシル)エチル基、シクロヘブチルメチル基、4-フルオロシクロヘキシルメチル基、2-メチルシクロペンチルメチル基、3-メチルシクロヘキシルメチル基、4-メチルシクロヘキシルメチル基、4,4-ジメチルシクロヘキシルメチル基、3,5-ジメチルシクロヘキシルメチル基、4-tert-ブチルシクロヘキシルメチル基、4-ヒドロキシシクロヘキシルメチル基、4-メトキシシクロヘキシルメチル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロシクロヘキシルメチル基が挙げられる。

また、シクロペンチルメチル基又はシクロヘキシルメチル基にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、tert-ブチル基、カルボキシ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシ基、カルバモイル基、メチルチオ基、ジメチルアミノカルボニル基、メチルスルホニル基又はアセチルアミノ基が置換したものが挙げられる。

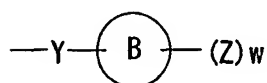
C3-8シクロアルキルC1-6アルキル基部位において好ましくは、シクロペンチルメチル基又はシクロヘキシルメチル基であり、R<sup>a20</sup>、R<sup>a27</sup>及びR<sup>a28</sup>において特に好ましくはシクロヘキシルメチル基である。

「カルボン酸保護基」としては、反応条件に適し、保護・脱保護可能な保護基であればよく、例えば、メチル基；メトキシメチル基、メチルチオメチル基、2-テトラヒドロピラニル基、メトキシエトキシメチル基、ベンジルオキシメチル基、フェナシル基、ジアシルメチル基、フタルイミドメチル基等の置換メチル基；エチル基；2,2,2-トリクロロエチル基、2-クロロエチル基、2-(トリ

メチルシリル) エチル基、2-メチルチオエチル基、2-(p-トルエンスルホニル) エチル基、t-ブチル基等の置換エチル基; ベンジル基; ジフェニルメチル基、トリフェニルメチル基、p-ニトロベンジル基、4-ピコリル基、p-メトキシベンジル基、2-(9, 10-ジオキソ) アンスリルメチル基等の置換ベンジル基; トリメチルシリル基、t-ブチルジメチルシリル基、フェニルジメチルシリル基等のシリル基等が挙げられる。

好ましくは工業的に有効な保護基であり、 $R^{36}$ として具体的に好ましくはメチル基、エチル基である。

一般式 [I] において、Xとして好ましくは、

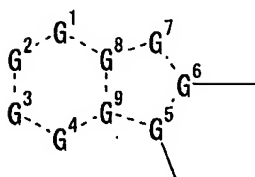


(式中、各記号の定義は前記の通り。) である。

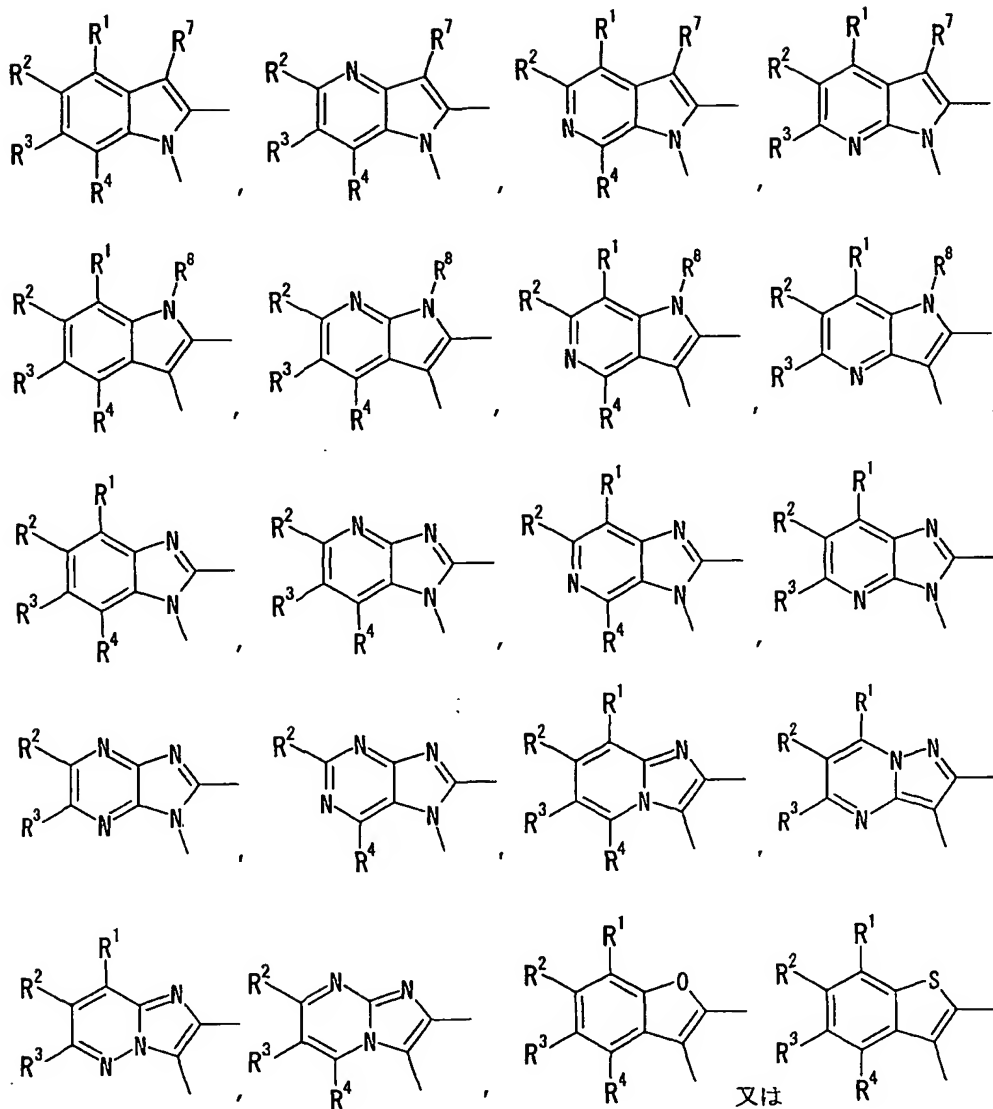
$G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$  及び  $G^4$  として好ましくは、それぞれ  $(C-R^1)$ 、 $(C-R^2)$ 、 $(C-R^3)$  及び  $(C-R^4)$  であり、 $G^5$  として好ましくは窒素原子であり、 $G^6$ 、 $G^8$  及び  $G^9$  として好ましくは炭素原子である。 $G^7$  として好ましくは、 $C(-R^7)$  又は無置換の窒素原子であり、この時  $R^7$  として好ましくは水素原子である。

組合せとして好ましくは、 $G^2$  が  $(C-R^2)$ 、かつ  $G^6$  が炭素原子であり、特に好ましくは、 $G^2$  が  $(C-R^2)$ 、 $G^6$  が炭素原子、かつ  $G^5$  が窒素原子であり、最も好ましくは、 $G^2$  が  $(C-R^2)$ 、 $G^6$  が炭素原子、 $G^5$  が窒素原子、かつ  $G^7$  が無置換の窒素原子である。

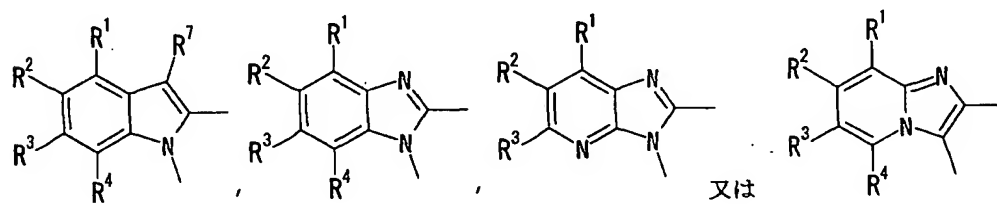
一般式 [I] 及び [II] の



部位において好ましくは、 $G^1$  乃至  $G^9$  のうち 1 乃至 4 個が窒素原子であるものであり、具体的に好ましくは、

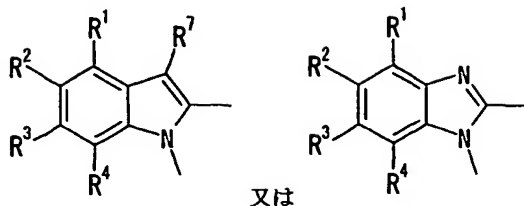


であり、特に好ましくは、

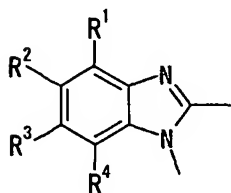


であり、更に好ましくは、

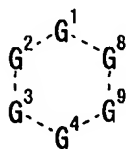




であり、最も好ましくは、



である。



部位が芳香環であることもまた、好ましい態様の一つである。

$R^1$  及び  $R^3$  において好ましくは水素原子又は  $-OR^{a6}$  ( $R^{a6}$  は前記定義の通り。) であり、特に好ましくは水素原子である。 $R^2$  において好ましくはカルボキシ基、 $-COOR^{a1}$ 、 $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、 $-SO_2R^{a7}$  (各記号は前記定義の通り。)、 $\text{「酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基」}$  であり、特に好ましくはカルボキシ基、 $-COOR^{a1}$  又は  $-SO_2R^{a7}$  であり、更に好ましくはカルボキシ基又は  $-COOR^{a1}$  であり、最も好ましくはカルボキシ基である。 $R^4$  において好ましくは水素原子である。

$R^{a1}$  において好ましくは、 $\text{「置換されてもよい C1-6 アルキル基」}$  である。

$R^2$  がカルボキシ基又は  $-COOR^{a1}$  のとき、 $R^1$ 、 $R^3$  又は  $R^4$  のいずれか一つ以上が水酸基、ハロゲン原子 (特にフッ素原子、塩素原子)、 $-OR^{a6}$  (ここで、 $R^{a6}$  として好ましくは水素原子、メチル基である。) であることも好ましい態様の一つである。

環  $C_y$  及び環  $C_{y'}$  において好ましくは、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、テトラヒドロチオピラニル基又はピペリジノ基であり、特に好ましくはシクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、

更に好ましくはシクロヘキシル基である。

環A及び環A'において好ましくはフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、フリル基又はチエニル基であり、特に好ましくはフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基又はピリダジニル基であり、更に好ましくはフェニル基又はピリジル基であり、最も好ましくはフェニル基である。

環B及び環B'において好ましくは「C1-6 アリール基」又は「ヘテロ環基」であり、具体的に好ましくは、フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、テトラゾリル基、チエニル基、フリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基又はチアジアゾリル基であり、特に好ましくはフェニル基、ピリジル基、ピリミジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基又はチアゾリル基であり、更に好ましくは、フェニル基、ピリジル基又はチアゾリル基であり、最も好ましくはフェニル基又はチアゾリル基である。

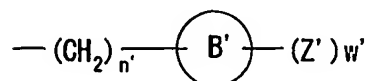
R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>においては、何れか一方が水素原子かつ他方がハロゲン原子、特にフッ素原子であるか、両者が水素原子であるときに好ましい。環Aがフェニル基のとき、R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>はG<sup>6</sup>-からオルト位に位置することが好ましい。またR<sup>5'</sup>及びR<sup>6'</sup>においても同様である。

Yにおいて好ましくは、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、 $-NHCO_2-$ 、 $-CONH-CHR^{a14}-$ 、 $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、 $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、 $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 又は $-(CH_2)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-$ （各記号の定義は前述の通り。）であり、更に好ましくは、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 又は $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ であり、最も好ましくは $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ である。

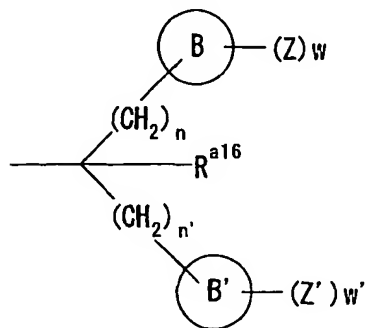
Yにおける1、m及びnにおいて好ましくは0又は1乃至4の整数であり、特に好ましくは0、1又は2である。 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ において更に好ましくはm=n=0若しくはm=0かつn=1であり、最も好ましくはm=0かつn=1である。また $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ において更に好

ましくは  $m = n = 0$ 、 $m = 0$  かつ  $n = 1$ 、 $m = 1$  かつ  $n = 0$  若しくは  $m = 1$  かつ  $n = 1$  であり、最も好ましくは  $m = 0$  かつ  $n = 1$  である。

Y が  $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  の時、 $R^{a16}$  として好ましくは水素原子であり、 $R^{a15}$  として好ましくは、



であり、この時、



部位は対称形であることが好ましく、 $n$ 、環 B、Z、 $w$  における好ましい態様と、 $n'$ 、環 B'、Z'、 $w'$  における好ましい態様はそれぞれ同一である。

環 A がフェニル基のとき、X 若しくは Y は  $G^6-$  に対してパラ位に位置することが好ましい。環 B 及び環 B' がフェニル基のとき Z は Y に対してオルト位若しくはメタ位に置換することが好ましく、フェニル基上の 3 位に 1 つの置換基が置換すること若しくはフェニル基上の 2 位及び 5 位に 1 つずつの置換基が置換することが好ましい。

また環 B がピリジン-2-イル基として Y に結合するとき、Z はピリジル基の 3 位、6 位に置換されることが好ましく、ピリジン-3-イル基として Y に結合するとき、Z はピリジル基の 2 位、5 位に置換されることが好ましく、ピリジン-4-イル基として Y に結合するとき、Z はピリジル基の 2 位、5 位に置換されることが好ましい。

また環 B がチアゾリル基のとき Y は 5 位に置換することが好ましく、この時 Z は 2 位、4 位若しくは 2 位及び 4 位に置換されることが好ましい。同様に環 B' がチアゾリル基のとき  $(CH_2)_{n'}$  もまた 5 位に置換することが好ましく、この時 Z' は 2 位、4 位若しくは 2 位及び 4 位に置換されることが好ましい。

Z及びZ'として好ましくはグループD、「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」又は「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」であり、特に好ましくはグループD又は「グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基」である。

更に好ましくは上記定義の「ハロゲン原子」、ニトロ基、上記定義の「置換されてもよいC1-6アルキル基」、 $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、 $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、 $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、 $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、 $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、 $-(CH_2)_t-S(O)_q-R^{a25}$ 又は $-(CH_2)_t-SO_2-NHR^{a26}$ 、或いはそれらで置換されてもよいC6-14アリール基又はヘテロ環基である。

Z及びZ'において、それぞれ環B及び環B'に直接置換するグループDの好ましい態様と、C6-14アリール基、C3-8シクロアルキル基、C6-14アリールC1-6アルキル基又はヘテロ環基上に置換するグループDの好ましい態様とは、同様なものが挙げられ、それぞれ同一若しくは異なってもよい。

具体的な置換基として好ましくは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、2-カルボキシエチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、カルバモイルメトキシメチル基、(ジメチルアミノカルボニル)メトキシメチル基、アセチル基、イソバレリル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、ヒドロキシアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、プロピルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ブチルアミノカルボニル基、イソブチルアミノカルボニル基、tert-ブチルアミノカルボニル基、(4-ヒドロキシブチル)アミノカルボニル基、(1-ヒドロキシプロパン-2-イル)アミノカルボニル基、(2,3-ジヒドロキシプロピル)アミノカルボニル基、(1,3-ジヒドロキシプロパン-2-イル)アミノカルボニル基、メトキシアミノカルボニル基、{2-[2-(メトキシ)エトキシ]エチル}アミノカルボニル基、N-エチル-N-メチルアミノカルボニル基、N-メチル

—N—プロピルアミノカルボニル基、N—イソプロピル—N—メチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2—ヒドロキシエチル)アミノカルボニル基、(2—ヒドロキシ—2—メチルプロパン—2—イル)アミノカルボニル基、(カルボキシルメチル)アミノカルボニル基、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、2—イソペンテニルオキシ基、3—イソヘキセニルオキシ基、4—メチル—3—ペンテニルオキシ基、2—プロピニルオキシ基、トリフルオロメチルオキシ基、ヒドロキシメチルオキシ基、カルボキシルメチルオキシ基、(ジメチルアミノカルボニル)メチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、N—アセチル—N—メチルアミノ基、N—アセチル—N—エチルアミノ基、N—アセチル—N—プロピルアミノ基、N—アセチル—N—イソプロピルアミノ基、N—エチルカルボニル—N—メチルアミノ基、N—エチル—N—(エチルカルボニル)アミノ基、ウレイド基、イソプロピルカルボニルアミノ基、イソブチルカルボニルアミノ基、tert—ブチルカルボニルアミノ基、(エチルアミノ)カルボニルアミノ基、(イソプロピルアミノ)カルボニルアミノ基、(ジメチルアミノ)カルボニルアミノ基、(4—ヒドロキシピペリジノ)カルボニルアミノ基、[(4—ヒドロキシピペリジノ)メチル]カルボニルアミノ基、[(3—ヒドロキシピロリジニル)メチル]カルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、N—(メチルスルホニル)—N—メチルアミノ基、N—(エチルスルホニル)—N—メチルアミノ基、N—(イソプロピルスルホニル)—N—メチルアミノ基、N—(メチルスルホニル)—N—エチルアミノ基、N—(メチルスルホニル)—N—プロピルアミノ基、N—(エチルスルホニル)—N—エチルアミノ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、イソプロピルアミノスルホニル基、tert—ブチルアミノスルホニル基、ヒドロキシアミジノ基、フェニル基、3—フルオロフェニル基、4—フルオロフェニル基、3—クロロフェニル基、4—クロロフェニル基、2, 4—ジフルオロフェ

ニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、4-クロロ-2-フルオロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-メチルフェニル基、4-エチルフェニル基、4-プロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-(ヒドロキシメチル)フェニル基、4-(2-ヒドロキシエチル)フェニル基、4-(メトキシメチル)フェニル基、4-(2-カルボキシルエチル)フェニル基、4-(メトキシカルボニルメチル)フェニル基、4-(エトキシカルボニルメチル)フェニル基、4-アセチルフェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、4-(メトキシカルボニル)フェニル基、4-(エトキシカルボニル)フェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-(メチルアミノカルボニル)フェニル基、4-(イソプロピルアミノカルボニル)フェニル基、4-(ジメチルアミノカルボニル)フェニル基、4-(ジエチルアミノカルボニル)フェニル基、4-[(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル]フェニル基、4-[(カルボキシルメチル)アミノカルボニル]フェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、4-プロピルオキシフェニル基、4-イソプロピルオキシフェニル基、4-ブチルオキシフェニル基、4-イソペンチルオキシフェニル基、4-(2-イソペンテニルオキシ)フェニル基、4-(3-イソヘキセニルオキシ)フェニル基、4-(4-メチル-3-ペンテニルオキシ)フェニル基、4-(2-プロピニルオキシ)フェニル基、4-(トリフルオロメチルオキシ)フェニル基、4-(ヒドロキシメチルオキシ)フェニル基、4-(カルボキシルメチルオキシ)フェニル基、4-[(ジメチルアミノカルボニル)メチルオキシ]フェニル基、4-アミノフェニル基、4-(メチルアミノ)フェニル基、4-(ジメチルアミノフェニル)基、4-(ジエチルアミノ)フェニル基、4-(アセチルアミノ)フェニル基、N-アセチル-N-メチルアミノ基、4-(N-アセチル-N-メチルアミノ基)フェニル基、4-(N-アセチル-N-エチルアミノ)フェニル基、4-(N-アセチル-N-プロピルアミノ)フェニル基、

4-(N-アセチル-N-イソプロピルアミノ)フェニル基、4-(N-エチルカルボニル-N-メチルアミノ)フェニル基、4-[N-エチル-N-(エチルカルボニル)アミノ]フェニル基、4-(メチルスルホニルアミノ)フェニル基、4-(メチルチオ)フェニル基、4-(メチルスルホニル)フェニル基、4-(メチルスルフィニル)フェニル基、4-(アミノスルホニル)フェニル基、4-(メチルアミノスルホニル)フェニル基、4-(ジメチルアミノスルホニル)フェニル基、4-(tert-ブチルアミノスルホニル)フェニル基、テトラゾール-5-イルフェニル基、シクロヘキシル基、ベンジル基、4-クロロベンジル基、フェネチル基、ベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、2-クロロベンジルオキシ基、3-クロロベンジルオキシ基、4-クロロベンジルオキシ基、4-tert-ブチルベンジルオキシ基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、2-チエニル基、2-チアゾリル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、6-フルオロピリジン-3-イル基、5-フルオロピリジン-2-イル基、6-クロロピリジン-3-イル基、6-メチルピリジン-3-イル基、2-ピリミジニル基、5-テトラゾリル基、ピペリジノ基、2-オキソピペリジン-1-イル基、2-オキソピロリジン-1-イル基、2-イミダゾリン-2-イル基、2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-オキソオキサゾリジン-1-イル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、5-メチルチアゾール-2-イル基、2-アミノチアゾール-4-イル基、3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル基、1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル基、4, 4-ジメチル- $\Delta^2$ -オキサゾリン-2-イル基、5-クロロチオフェン-2-イル基、5-メチルオキサゾール-2-イル基、5-オキソ- $\Delta^2$ -1, 2, 4-オキサジアゾリン-3-イル基、5-オキソ- $\Delta^2$ -1, 2, 4-チアジアゾリン-3-イル基、2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリン-4-イル基、4-ヒドロキシピペリジノメチル基、ピペリジノカルボニル基、4-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、3, 4-ジヒドロキシピペリジノカルボニル基、1-ピペラジニルカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、モルホリノカルボニル基、4-チオモルホリニルカルボニル基、フェノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、テトラヒドロピラニルオ

キシ基、2-ピリジルメチルオキシ基、3-ピリジルメチルオキシ基、2-クロロピリジン-4-イルメチルオキシ基、4-ピリジルメチルオキシ基、2-ペリジルメチルオキシ基、3-ペリジルメチルオキシ基、4-ペリジルメチルオキシ基、1-メチルピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イルメチルオキシ基、2-メチルチアゾリン-4-イルオキシ基、2,4-ジメチルチアゾリン-5-イルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルメチルオキシ基、ピペリジノカルボニルメチルオキシ基、4-ヒドロキシピペリジノカルボニルメチルオキシ基、2-メチルチアゾール-4-イル基、(2-メチルチアゾール-4-イル)メチルオキシ基、(2,4-ジメチルチアゾール-5-イル)メチルオキシ基、ベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-クロロベンジルアミノ基、3,5-ジクロロベンジルアミノ基、4-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、2-ピリジルメチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、4-クロロベンゾイルアミノ基、4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ基、3,5-ジクロロベンゾイルアミノ基、3-ニトロ-4-メトキシベンゾイルアミノ基、4-ニトロ-3-メトキシベンゾイルアミノ基、3-ピリジルカルボニルアミノ基、モルホリノカルボニルアミノ基、2-オキサゾリニルアミノ基、4-ヒドロキシピペリジノスルホニル基、4-メチルフエニルスルホニルアミノ基、2-チアゾリルアミノスルホニル基、2-ピリジルアミノスルホニル基、ベンジルアミノカルボニル基、N-ベンジル-N-メチルアミノカルボニル基、(4-ピリジルメチル)アミノカルボニル基、(シクロヘキシルメチル)アミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、3-ヒドロキシプロピルオキシ基、2-メトキシエトキシ基、2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ基、アゼチジニルカルボニル基、3-ヒドロキシピロリジニルカルボニル基、3-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、4-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、3,4-ジヒドロキシピペリジノカルボニル基、4-メトキシピペリジノカルボニル基、4-カルボキシピペリジノカルボニル基、4-(ヒドロキシメチル)ピペリジノカルボニル基、2-オキソピペリジノカルボニル基、4-オキソピペリジノカルボニル基、2,6-ジメチルピペ



リジノカルボニル基、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジノカルボニル基、2, 2, 6, 6-テトラメチル-4-ヒドロキシピペリジノカルボニル基、1-オキシチオモルホリン-4-イルカルボニル基、1, 1-ジオキシチオモルホリン-4-イルカルボニル基、1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イルアミノカルボニル基、4-メチルスルホニルピペラジニルカルボニル基、4-メチルピペラジニルカルボニル基、N, N-ビス(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、シクロプロピルアミノカルボニル基、シクロブチルアミノカルボニル基、シクロヘキシルアミノカルボニル基、4-ヒドロキシシクロヘキシルアミノカルボニル基、4-メチルチアゾール-2-イルメチルアミノカルボニル基、2-(4-ヒドロキシピペリジノ)エチルオキシ基、2-ピリジルメチルアミノカルボニル基、3-ピリジルメチルアミノカルボニル基、N-メチル-N-(4-ピリジルメチル)アミノカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシ基、4-ヒドロキシピペリジノカルボニルメチルオキシ基又は4-メチルチアゾール-2-イルメチルオキシ基である。

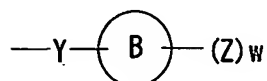
具体的な置換基として特に好ましくは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、ヒドロキシメチル基、カルボキシ基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(2-ヒドロキシエチル)アミノカルボニル基、(カルボキシメチル)アミノカルボニル基、メトキシ基、2-イソペンテニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、メチルチオ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、N-アセチル-N-メチルアミノ基、N-アセチル-N-エチルアミノ基、N-アセチル-N-プロピルアミノ基、N-アセチル-N-イソプロピルアミノ基、N-エチルカルボニル-N-メチルアミノ基、N-エチル-N-(エチルカルボニル)アミノ基、メチルスルホニルアミノ基、メチルスルホニル基、アミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、tert-ブチルアミノスルホニル基、フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル

ル基、4-（メトキシメチル）フェニル基、4-（2-ヒドロキシルエチル）フェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-（ジメチルアミノカルボニル）フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、ベンジル基、フェネチル基、ベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、4-クロロベンジルオキシ基、2-チアゾリル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、4-ピリジルメチルオキシ、2-ピペリジルメチルオキシ基、3-ピペリジルメチルオキシ基、4-ピペリジルメチルオキシ基、1-メチルピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-アセチルピペリジン-4-イルメチルオキシ基、2-クロロピペリジン-4-イルメチルオキシ基、1-（メチルスルホニル）ピペリジン-4-イルメチルオキシ基、2-メチルチアゾール-4-イル基、（2-メチルチアゾール-4-イル）メチルオキシ基、（2, 4-ジメチルチアゾール-5-イル）メチルオキシ基、5-テトラゾリル基、3-フルオロベンゾイル基、ピペリジノカルボニル基、4-ヒドロキシルピペリジノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、モルホリノカルボニル基、4-チオモルホリニルカルボニル基、ベンジルアミノカルボニル基、N-ベンジル-N-メチルアミノカルボニル基、（4-ピリジルメチル）アミノカルボニル基又は（シクロヘキシルメチル）アミノカルボニル基であり、

具体的な置換基として最も好ましくは、フッ素原子、塩素原子、メチル基、ヒドロキシメチル基、カルボキシル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メトキシ基、メチルアミノ基、アセチルアミノ基、アミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、tert-ブチルアミノスルホニル基、フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-カルボキシルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-（ジメチルアミノカルボニル）フェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、2-オキソピロリジン-1-イル基である。

また  $w$  として好ましくは 1 又は 2 であり、 $r$ 、 $t$  において好ましくは 0、1 又は 2 であり、特に好ましくは 0 又は 1 であり、更に好ましくは 0 であり、 $p$  として好ましくは 1 であり、 $q$  として好ましくは 0 又は 2 である。

一般式 [I] において、 $X$  が



(式中、各記号の定義は前記の通り。) であり、 $w$  が 2 以上であるとき、 $Z$  の 1 つが「グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基」又は「グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」であることが望ましく、「グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基」が特に好ましい。

また環 B がフェニル基であり、 $w$  が 2 であり、フェニル基が Y に結合する位置を 1 位とした場合、フェニル基の 2 位及び 5 位に  $Z$  が結合し、2 位の  $Z$  が「グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基」であり、5 位の  $Z$  が「グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」であるときが最も好ましい態様の 1 つである。

また、「製薬上許容されるその塩」とは、上記一般式 [I] 又は [II] で示される化合物と無毒の塩を形成するものであればいかなる塩でもよく、例えば塩酸、硫酸、リン酸、臭化水素酸等の無機酸；又はシュウ酸、マロン酸、クエン酸、フマル酸、乳酸、リンゴ酸、コハク酸、酒石酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、グルコン酸、アスコルビン酸、メチルスルホン酸、ベンジルスルホン酸、メグルミン酸等の有機酸；又は水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、水酸化アンモニウム等の無機塩基；又はメチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン、トリエタノールアミン、エチレンジアミン、トリス (ヒドロキシメチル) メチルアミン、グアニジン、コリン、シンコニン等の有機塩基；又はリジン、アルギニン、アラニン等のアミノ酸と反応させることにより得ることができる。なお、本発明においては各化合物の含水物或いは水和物及び溶媒和物も包含される。

また、上記一般式 [I] 又は [II] で示される化合物においては、種々の異性

体が存在する。例えば、幾何異性体としてE体及びZ体が存在し、また、不斉炭素原子が存在する場合は、これらに基づく立体異性体としての鏡像異性体及びジアステレオマーが存在する。場合によっては互変異性体が存在し得る。従って、本発明の範囲にはこれらすべての異性体及びそれらの混合物が包含される。

なお、本発明においては各化合物のプロドラッグ及び代謝物も包含される。

「プロドラッグ」とは、化学的又は代謝的に分解し得る基を有し、生体に投与された後、元の化合物に復元して本来の薬効を示す本発明化合物の誘導体であり、共有結合によらない複合体及び塩を含む。

本発明化合物を医薬製剤として用いる場合、通常それ自体公知の製薬上許容される担体、賦形剤、希釈剤、増量剤、崩壊剤、安定剤、保存剤、緩衝剤、乳化剤、芳香剤、着色剤、甘味剤、粘稠剤、矯味剤、溶解補助剤、その他添加剤、具体的には水、植物油、エタノール又はベンジルアルコール等のアルコール、ポリエチレングリコール、グリセロールトリアセテート、ゼラチン、ラクトース、デンプン等の炭水化物、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ラノリン、ワセリン等と混合して、常法により錠剤、丸剤、散剤、顆粒、坐剤、注射剤、点眼剤、液剤、カプセル剤、トローチ剤、エアゾール剤、エリキシル剤、懸濁剤、乳剤、シロップ剤等の形態となすことにより、全身的或るいは局所的に、経口若しくは非経口で投与することができる。

投与量は年齢、体重、症状、治療効果、投与方法等により異なるが、通常、成人ひとり当たり、1回に0.1mg乃至1gの範囲で、1日1回乃至数回が投与される。

「C型肝炎の予防」とは、例えば検査等によりHCVが検出された人であってC型肝炎の症状が現われていない人に対し薬剤を投与すること、或はC型肝炎の治療後、肝炎の症状が改善された人であってHCVが根絶されておらず肝炎の再発が懸念される人に対し薬剤を投与することが挙げられる。

また、本発明のC型肝炎治療剤は、他の抗ウイルス剤、抗炎症剤、免疫増強剤との併用によって、相乗効果を期待する事ができる。

相乗効果の期待できる薬剤としては、例えば、インターフェロン- $\alpha$ 、インターフェロン- $\beta$ 、インターフェロン- $\gamma$ 、インターロイキン-2、インターロイ

キン-8、インターロイキン-10、インターロイキン-12、TNF $\alpha$ 又はそれらの組換体、修飾体、アゴニスト、或いは、抗体、ワクチン、リボザイム、アンチセンスヌクレオチド等が挙げられる。

抗HIV剤の併用療法（カクテル療法とも呼ばれる。）に見られるように、遺伝子の変異が多いウイルスに対し各種抗ウイルス剤を併用する事は、薬剤耐性ウイルスの出現・増加を抑えるためにも効果が期待できる。HCV-IRES阻害剤、HCV-NS3プロテアーゼ阻害剤、HCV-NS2NS3プロテアーゼ阻害剤、HCV-NS5A阻害剤、HCVポリメラーゼ阻害剤との2剤或いは3剤以上の併用が挙げられ、例えば、リバビリン(R)、インターフェロン- $\alpha$  (IFN- $\alpha$ 、Roferon (R)、Intron A (R)、Sumiferon (R)、MultiFeron (R)、Infergen (R)、OmniFeron (R)、Pegasys (R)、PEG-Intron A (R))、インターフェロン- $\beta$  (Feron (R)、Rebif (R)、Avonex (R)、IFN $\beta$ MOCHIDA (R))、インターフェロン- $\omega$ 、1- $\beta$ -L-リボフラノシル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキサミド、16 $\alpha$ -プロモ-3 $\beta$ -ヒドロキシ-5 $\alpha$ -アンドロスタン-17-オン、1H-イミダゾール-4-エタナミド ジヒドロクロライド、HCVリボザイムHeptazyme (R)、ポリクローナル抗体Civacir (R)、ラクトフェリンGPX-400、(1S, 2R, 8R, 8aR)-1, 2, 8-トリヒドロキシオクタヒドロインドリジジニウム クロリド、HCVワクチン(MTH-68/B、Innivax C (R)、Engerix B (R))、アンチセンスオリゴヌクレオチドISIS-14803、HCV-RNA転写酵素阻害剤VP-50406、テトラクロロデカオキシド（高濃度Oxoferin (R))、(S)-N-3-[3-(3-メトキシ-4-オキサゾール-5-イルフェニル)ウレイド]ベンジルカルバミン酸 テトラヒドロフラン-3-イルエステル、4-アミノ-2-エトキシメチル- $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメチル-1H-イミダゾ [4, 5-c]キノリン-1-エタノール、インターロイキン-2 (Proleukin (R))、サイモシン $\alpha$ 1等との併用が挙げられる。

(R)は商品名であることを示す。

HCV-IRES阻害剤として、特開平8-268890号、特開平10-1

01591号、特開平7-69899号、WO99/61613号、HCVプロテアーゼ阻害剤として、WO98/22496号、WO99/7733号、WO99/7734号、WO00/9543号、WO00/9558号、WO01/59929号、WO98/17679号、EP932617号、WO99/50230号、WO00/74768号、WO97/43310号、US5990276号、WO01/58929号、WO01/77113号、WO02/8198号、WO02/8187号、WO02/8244号、WO02/8256号、WO01/7407号、WO01/40262号、WO01/64678号、WO98/46630号、特開平11-292840号、特開平10-298151号、特開平11-127861号、特開2001-103993号、WO98/46597号、WO99/64442号、WO00/31129号、WO01/32961号、WO93/15730号、US7832236号、WO00/200400号、WO02/8251号、WO01/16379号、WO02/7761号、HCVヘリカーゼ阻害剤として、WO97/36554号、US5830905号、WO97/36866号、US5633388号、WO01/7027号、WO00/24725号、HCVポリメラーゼ阻害剤として、WO00/10573号、WO00/13708号、WO00/18231号、WO00/6529号、WO02/6246号、WO01/32153号、WO01/60315号、WO01/77091号、WO02/4425号、WO02/20497号、WO00/4141号、インターフェロンアゴニスト或いは増強剤として、WO01/58877号、特開平11-180981号、WO01/12214号等の公報に記載される化合物等との併用も挙げられる。

HCVは遺伝子の変異が多いウイルスとして知られるため、多くの遺伝子型に効果がある化合物は、好ましい態様の一つである。また、薬剤としてHCV感染動物に投与されたとき、動物内で高い血中濃度を確保できることも好ましい態様の一つである。これらの点において、HCV1a型、1b型の両方に高い阻害活性を示し、かつ高い血中濃度を示す化合物、例えば、2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボ

ン酸 塩酸塩は、特に好ましい態様の一つである。

次に、本発明を実施するために用いる化合物の製造方法の一例を説明する。しかしながら、本発明化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

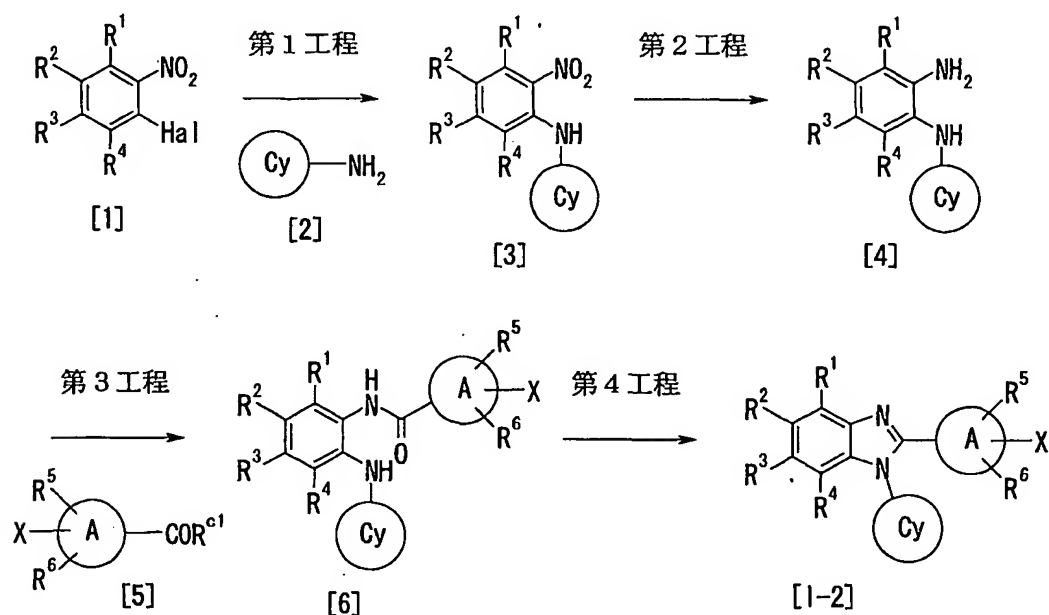
本製法に記載はなくとも、必要に応じて官能基に保護基を導入し後工程で脱保護を行う、各製法及び工程の順序を入れ替えるなどの工夫により効率よく製造を行えばよい。

また、各工程において、反応後の処理は通常行われる方法で行えばよく、単離精製、結晶化、再結晶化、シリカゲルクロマトグラフィー、分取HPLC等の慣用される方法を適宜選択し、また組み合わせて行えばよい。

#### 製法 1

本製法は、ニトロベンゼン化合物からベンゾイミダゾール化合物を形成する方法である。

##### 製法 1 - 1



(式中、Hal は塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子を示し、 $R^{\text{e1}}$  は塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子又は水酸基を示し、その他各記号は前述の通りである。)

##### 第1工程

常法により得られる若しくは市販の化合物〔１〕を、*N,N*-ジメチルホルムアミド（DMF）、アセトニトリル、テトラヒドロフラン（THF）、トルエン等の溶媒中、炭酸カリウム、トリエチルアミン、カリウム *t*-ブトキシド等の塩基の存在下、或は非存在下、室温又は加熱条件下で、アミン化合物〔２〕と反応させることにより化合物〔３〕を得ることが出来る。

#### 第２工程

化合物〔３〕をメタノール、エタノール、THF、酢酸エチル、酢酸、水等の溶媒中、パラジウム炭素、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネーニッケル等の触媒の存在下、室温又は加熱条件下で水素化することにより化合物〔４〕を得ることが出来る。また、化合物〔３〕を亜鉛、鉄、塩化第一スズ、亜硫酸ナトリウム等の還元剤で還元する、或は塩化第二鉄の存在下、ヒドラジンと反応させることにより化合物〔４〕を得ることも出来る。また、化合物〔３〕をアルカリ性条件下でヒドロサルファイトナトリウムと反応させることにより化合物〔４〕を得ることも出来る。

#### 第３工程

化合物〔４〕を、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ジシクロヘキシルカルボジイミドや、１-エチル-３-(３-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド・塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジド等の縮合剤及び必要に応じて*N*-ヒドロキシスクシンイミド、１-ヒドロキシベンゾトリアゾール等を加えて、カルボン酸化合物〔５〕と縮合することによりアミド化合物〔６〕を得ることが出来る。また、カルボン酸化合物〔５〕を塩化チオニル、塩化オキサリル等で誘導される酸ハライドとする、或は、クロロ炭酸エチル等により誘導される混合酸無水物とする等により化合物〔５〕の活性化エステルとし、次いで、トリエチルアミン、炭酸カリウム、ピリジン等の塩基存在下、或はピリジン等のアミン溶媒中で反応させることによりアミド化合物〔６〕を得ることも出来る。

#### 第４工程

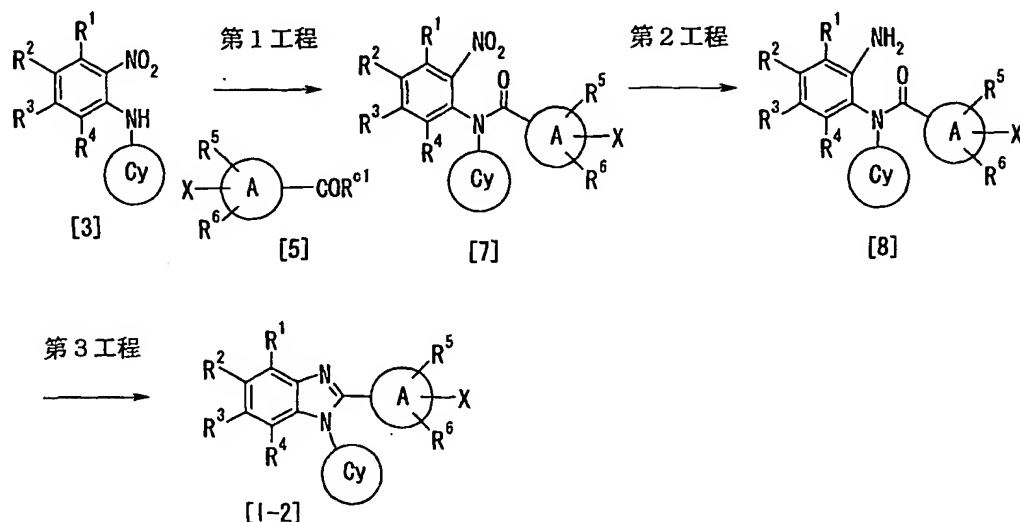
化合物〔６〕をエタノール、メタノール、トルエン、DMF、クロロホルム等の溶媒中若しくは無溶媒中、酢酸、ぎ酸、塩酸、希硫酸、リン酸、ポリリン酸、



p-トルエンスルホン酸等の酸や塩化亜鉛、オキシ塩化リン、塩化チオニル等のハロゲン化剤或は無水酢酸等の酸無水物の存在下、加熱し環化反応させることにより化合物[I-2]を得ることが出来る。

### 製法 1-2

本製法は、化合物[I-2]を製造する別法である。



(式中、各記号は前述の通りである。)

### 第1工程

製法1-1の第1工程と同様にして得られる化合物[3]を、製法1-1の第3工程と同様の方法で化合物[5]とアミド縮合することにより、化合物[7]を得ることができる。

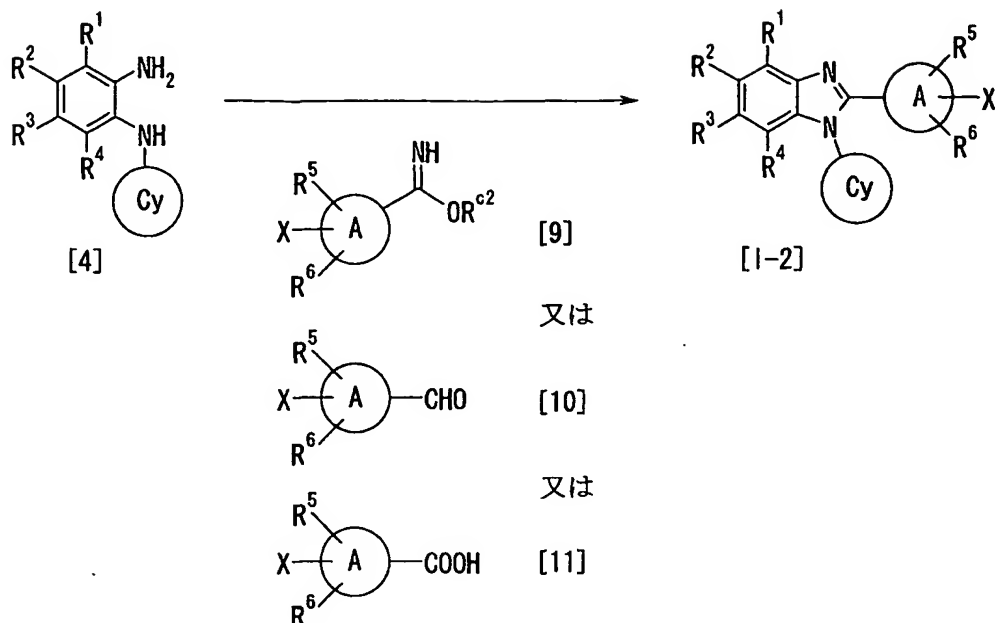
### 第2工程

化合物[7]を製法1-1の第2工程と同様の方法で還元することにより、化合物[8]を得ることができる。

### 第3工程

化合物[8]を製法1-1の第4工程と同様の方法で環化することにより、化合物[I-2]を得ることができる。

### 製法 1-3



(式中、 $R^{c2}$ はメチル基、エチル基等のアルキル基を示し、その他各記号は前述の通りである。)

化合物 [4] をイミダート化合物 [9] と、メタノール、エタノール、酢酸、DMF、THF、クロロホルム等の溶媒中、室温又は加熱条件下で反応させることにより化合物 [I-2] を得ることが出来る。

また、化合物 [4] を、酢酸、ぎ酸、アセトニトリル、DMF、ニトロベンゼン、トルエン等の溶媒中、ベンゾフロキサン、二酸化マンガン、2, 3-ジクロロ-5, 6-ジシアノー-p-ベンゾキノン、ヨウ素、フェリシアン酸カリウム等の酸化剤の存在下或は非存在下で、加熱下、アルデヒド化合物 [10] と反応させることにより化合物 [I-2] を得ることも出来る。

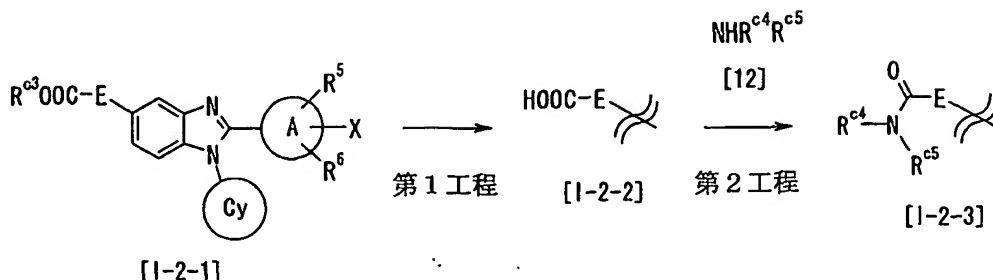
或は、化合物 [4] とカルボン酸化合物 [11] を、ポリリン酸、リン酸、オキシ塩化リン、塩酸等存在下で直接加熱反応することにより化合物 [I-2] を得ることも出来る。

## 製法 2

本製法では、ベンゾイミダゾールのベンゼン環上の置換基  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  の変換方法を示す。なおここでは、 $R^1$ ,  $R^3$  及び  $R^4$  が水素原子である場合の  $R^2$  の変換方法を示すが、本製法は置換位置に依らず用いることができる。

## 製法 2-1

カルボン酸エステル部位をアミドへ変換する方法。



{式中、Eは単結合、 $-(CH_2)_s-$ 、 $-O-(CH_2)_s-$ 又は $-NH-(CH_2)_s-$ （ここで、sは1乃至6の整数である。）であり、 $R^{c3}$ 、 $R^{c4}$ 及び $R^{c5}$ は、 $C_{1-6}$ アルキル基であり、その他各記号は前述の通りである。}

## 第1工程

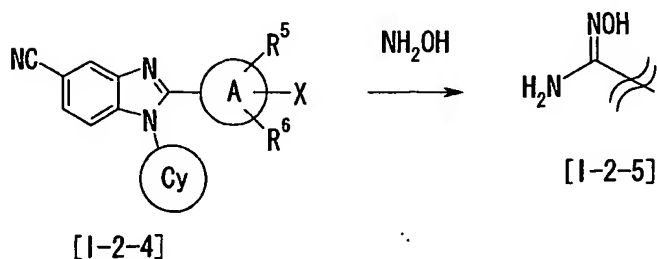
上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-1] を、メタノール、エタノール、THF、ジオキサン等の溶媒中、それらの混合溶媒中、若しくはそれら溶媒と水との混合溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水酸化リチウム等の塩基性条件下、或は、塩酸、硫酸等の酸性条件下で加水分解することにより化合物 [I-2-2] を得ることが出来る。

## 第2工程

化合物 [I-2-2] を、製法 1-1 の第3工程と同様の方法で化合物 [12] と反応させることにより、化合物 [I-2-3] を得ることが出来る。

## 製法 2-2

シアノ基を置換アミジノ基へ変換する方法。



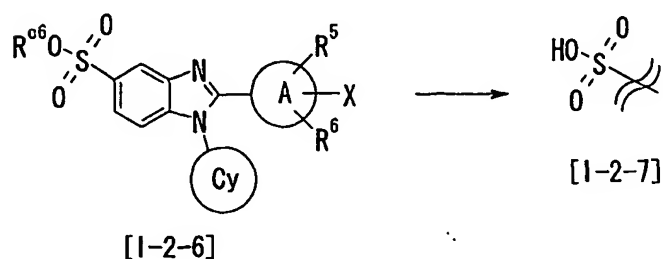
(式中、各記号は前述の通りである。)

上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-4] を、水、メタノール、エタノール、THF、DMF等の溶媒中、ヒドロキシルアミンと反応させることにより化

化合物 [I-2-5] を得ることが出来る。ヒドロキシルアミンの塩酸塩等の塩を用いる場合は、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、トリエチルアミン等の塩基の存在下で反応を行えばよい。

### 製法 2-3

スルホン酸エステル部位をスルホン酸へ変換する方法。



(式中、 $R^6$ は $C_{1-6}$ アルキル基であり、その他各記号の定義は前述の通りである。)

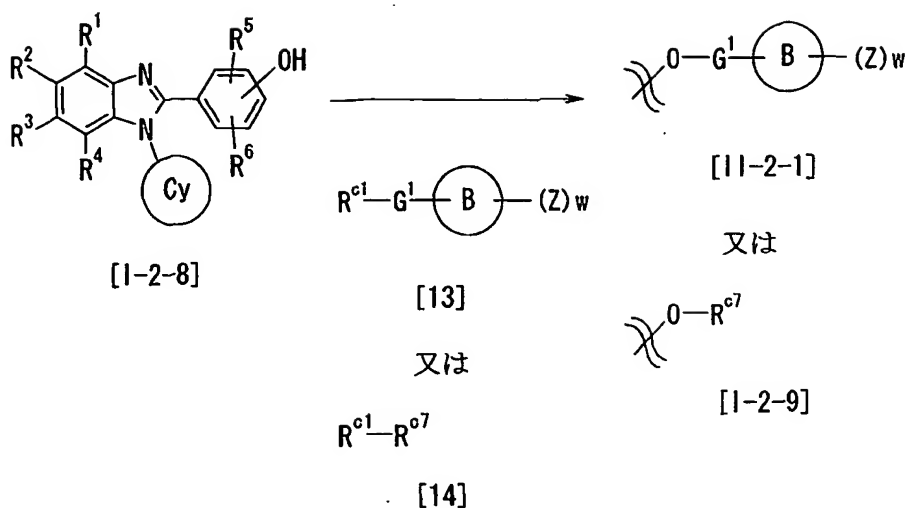
上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-6] を、DMF、ジメチルスルホキシド (DMSO)、アセトニトリル、メタノール、エタノール、水等の溶媒中、ヨウ化ナトリウム、ヨウ化リチウム等のヨウ化物塩、臭化ナトリウム、トリメチルアンモニウムブロミド等の臭化物塩、ピリジン、トリメチルアミン、トリアゾール等のアミン、トリフェニルホスフィン等のホスフィンと加熱下、反応させることにより [I-2-7] を得ることが出来る。

### 製法 3

本製法は、ベンゾイミダゾールの 2 位に置換するフェニル基上の置換基を変換する方法である。なお、フェニル基が他の環であっても本製法を用いることができる。

### 製法 3-1

水酸基をエーテルに変換する方法。



{式中、 $R^{c7}$ は $R^{c11}$ に対応する置換されてもよいアルキル基であり、 $G^1$ は単結合、 $*(CH_2)_n-$ 、 $*(CH_2)_n-O-$ 、 $*(CH_2)_n-CO-$ 又は $*(CH_2)_n-CR^{c15}R^{c16}-(CH_2)_n-$ を示し、ここで\*は $R^{c1}$ に結合する側を示し、その他各記号の定義は前述の通りである。}

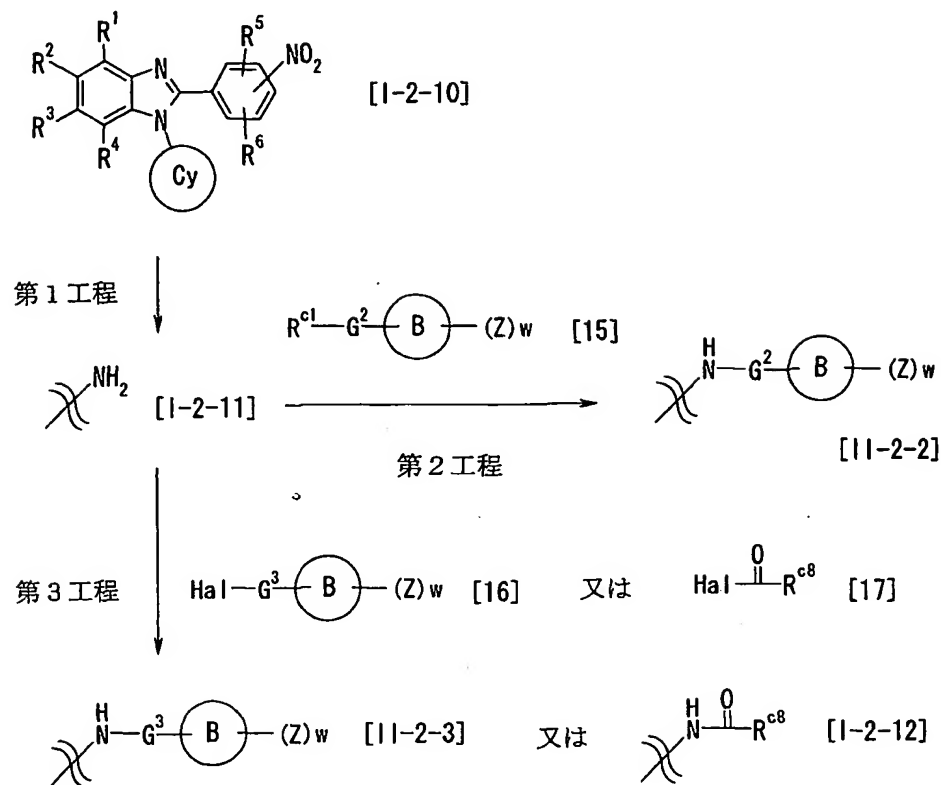
化合物 [13] において $R^{c1}$ がハロゲン原子である場合、上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-8] を、DMF、DMSO、アセトニトリル、エタノール、THF等の溶媒中、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、ナトリウムエトキシド、カリウム $t$ -ブトキシド等の塩基存在下、室温又は加熱条件で、化合物 [13] と反応させることにより化合物 [II-2-1] を得ることが出来る。

また、化合物 [13] において $R^{c1}$ が水酸基である場合、化合物 [13] の水酸基を、塩化チオニル、三臭化リン、四臭化炭素ートリフェニルホスフィン等でハロゲン原子に変えた後、前述の方法で化合物 [I-2-8] と反応させることにより化合物 [II-2-1] を得ることが出来る。また、この場合、化合物 [I-2-8] を、DMF、アセトニトリル、THF等の溶媒中、トリフェニルホスフィン-アゾジカルボン酸ジエチル等により化合物 [13] と光延反応をさせることにより化合物 [II-2-1] を得ることも出来る。

同様にして化合物 [I-2-8] 及び化合物 [14] より化合物 [I-2-9] を得ることが出来る。

## 製法 3-2

ニトロ基を置換アミノ基に変換する方法。



{式中、 $\text{R}^{\text{c}8}$ は $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を示し、 $\text{G}^2$ は $*-(\text{CH}_2)_n-$ 又は $*-\text{CHR}^{\text{a}15}-$ を示し、 $\text{G}^3$ は $-\text{CO}-$ 、 $*-\text{CO}_2-$ 、 $*-\text{CONH}-$ 又は $-\text{SO}_2-$ を示し、その他各記号は前述の通りである。}

## 第1工程

上記製法と同様にして得られるニトロ化合物 [I-2-10] から、製法 1-1 の第2工程と同様の方法で反応を行うことにより化合物 [I-2-11] を得ることが出来る。

## 第2工程

化合物 [I-2-11] を、製法 3-1 と同様の方法により化合物 [15] でアルキル化することにより化合物 [II-2-2] を得ることが出来る。

## 第3工程

化合物 [16] において $\text{G}^3$ が $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 及び $-\text{CONH}-$ の場合、化

化合物 [I-2-11] を、製法 1-1 の第 3 工程と同様の方法で化合物 [16] でアシル化することにより化合物 [II-2-3] を得ることが出来る。

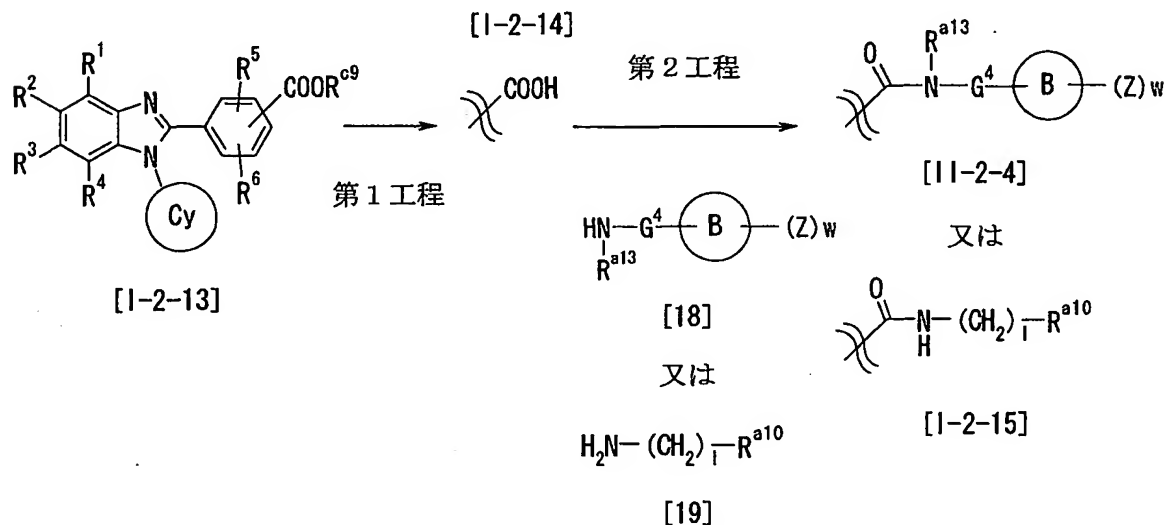
また、化合物 [16] において  $G^3$  が  $-SO_2-$  の場合、製法 1-1 の第 3 工程で用いた酸ハロゲン化物に換えてスルホンルハライドを用いてスルホン化することにより、化合物 [II-2-3] を得ることが出来る。

同様にして化合物 [I-2-11] を、化合物 [17] でアシル化することにより化合物 [I-2-12] を得ることが出来る。

また、同様にして本製法を用いることにより化合物 [II-2-2]、化合物 [II-2-3] 及び化合物 [I-2-12] のジ置換体（三級アミン）を得ることが出来る。

### 製法 3-3

カルボン酸エステル部位をアミドに変換する方法。



(式中、 $R^{c9}$  は  $C_{1-6}$  アルキル基を示し、 $G^4$  は  $\#-(CH_2)_n-$ 、 $\#-(CH_2)_n-NH-$ 、 $\#-CHR^{a14}-$  を示し、ここで  $\#$  は反応するアミンに結合する側を示し、その他各記号は前述の通りである。)

### 第 1 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-13] を、製法 2-1 の第 1 工程と同様の方法で反応させることにより、化合物 [I-2-14] を得ることが出来る。

### 第 2 工程

化合物 [I-2-14] を製法 2-1 の第 2 工程と同様の方法で化合物 [18] と反応

させることにより、化合物 [II-2-4] を得ることが出来る。

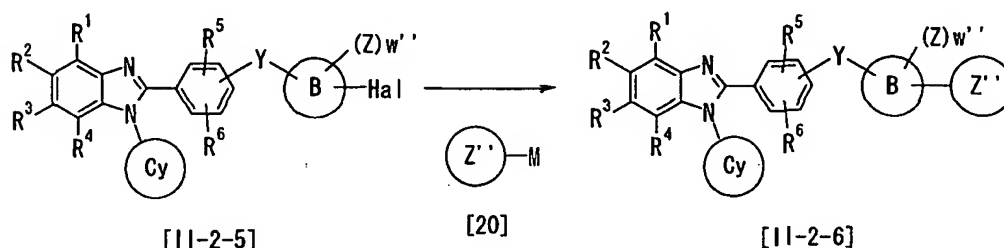
また同様にして化合物 [I-2-14] 及び化合物 [19] より化合物 [I-2-15] を得ることが出来る。

#### 製法 4

本製法は、ベンゾイミダゾールの 2 位に置換するフェニル基上の環 B に対し、更に置換基を導入する方法である。なお、フェニル基が他の環であっても本製法を用いることができる。

##### 製法 4-1

環 B に更に環 Z'' を直結させる方法。



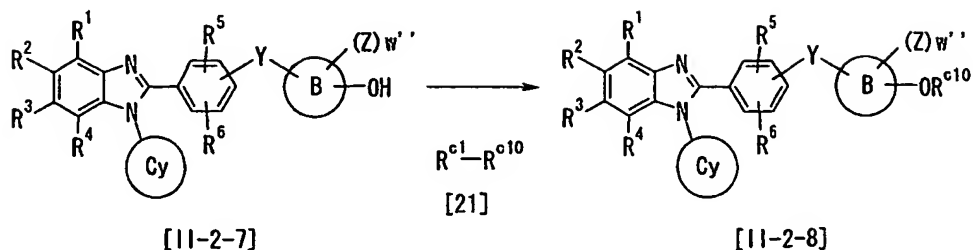
(式中、環 Z''-M はアリール金属化合物を示し、環 Z'' 部位は置換基 Z に対応する置換されてもよい C<sub>6-14</sub> アリール基、置換されてもよいヘテロ環基、金属部位にはホウ素、亜鉛、スズ、マグネシウム等が含まれ、例えばフェニルボロン酸、4-クロロフェニルボロン酸であり、w' は 0、1 又は 2 であり、その他各記号は前述の通りである。)

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-5] を、DMF、アセトニトリル、1, 2-ジメトキシエタン、THF、トルエン、水等の溶媒中、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、ビストリフェニルホスフィンパラジウム(II)ジクロリド、酢酸パラジウム-トリフェニルホスフィン等のパラジウム触媒や、塩化ニッケル、塩化 1, 3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパンニッケル(II)等のニッケル触媒、及び炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、リン酸カリウム、トリエチルアミン等の塩基存在下、室温又は加熱条件で、アリール金属化合物 [20] と反応させることにより化合物 [II-2-6] を得ることが出来る。

##### 製法 4-2



水酸基をエーテルに変換する方法。

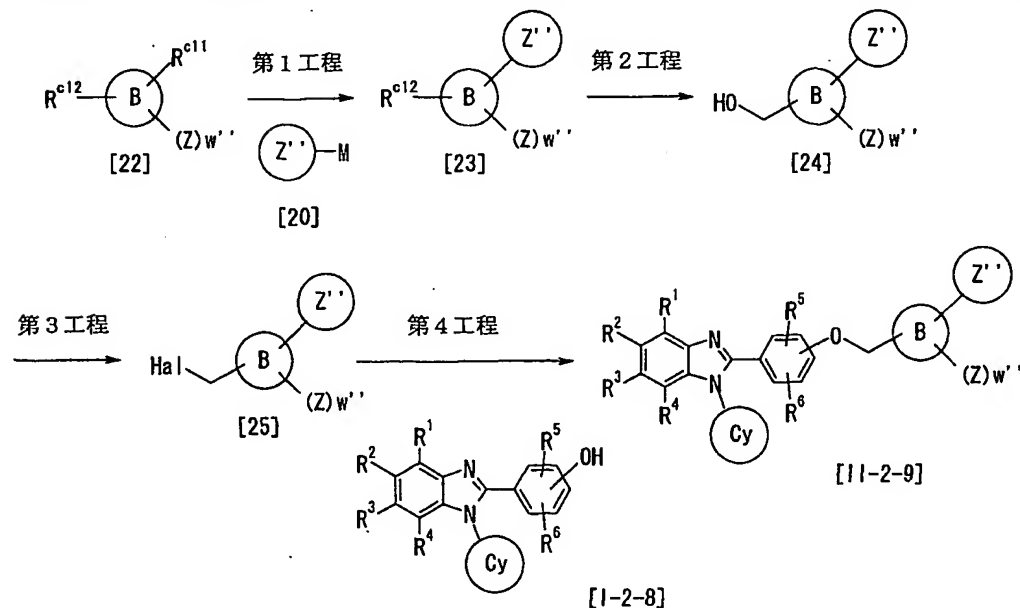


(式中、 $R^{c10}$ は置換基Zに対応する $-R^{a20}$ 又は $-(CH_2)_p-COR^{a21}$ を示し、その他各記号は前述の通りである。)

上記製法で得られる化合物 [II-2-7] から、製法 3-1 の方法と同様にして化合物 [21] と反応させることにより、化合物 [II-2-8] を得ることが出来る。

#### 製法 4-3

製法 3-1 における化合物 [13] の様な環B部分を、予め合成する方法。



(式中、 $R^{c11}$ は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基等の脱離基であり、 $R^{c12}$ はホルミル基、カルボキシル基或いはメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等のカルボン酸エステルを示し、その他各記号は前述の通りである。)

#### 第1工程

市販若しくは常法により得られる化合物 [22] を、製法 4-1 と同様の方法で

アリール金属化合物 [20] と反応させることにより、化合物 [23] を得ることが出来る。

## 第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [23] を、常法により還元することにより、化合物 [24] を得ることが出来る。

例えば、化合物 [23] を、メタノール、エタノール、THF等の溶媒中、水素化アルミニウムリチウム、水素化ホウ素ナトリウム等の還元剤の存在下、冷却乃至加熱条件下で反応させることにより化合物 [24] を得ることが出来る。

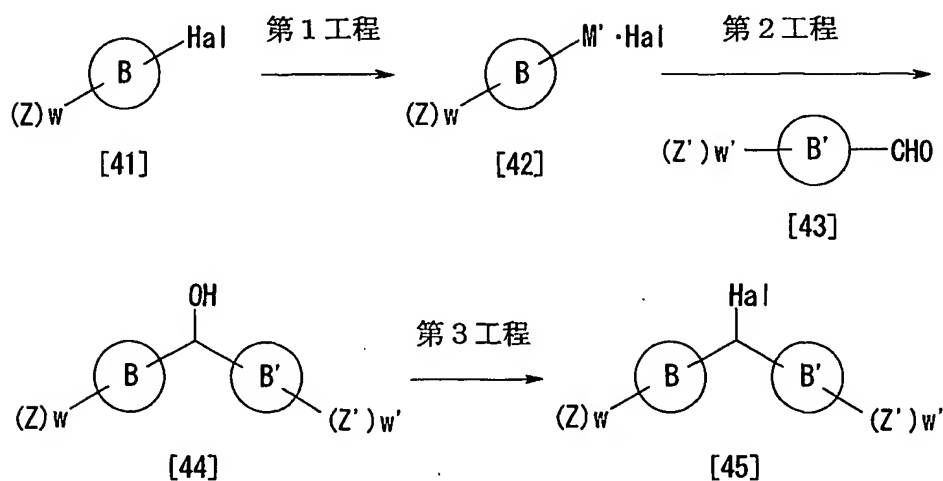
## 第3工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [24] を、1, 4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF、ジクロロメタン、クロロホルム、トルエン等の溶媒中、五塩化リン、三臭化リン等のハロゲン化リン又は塩化チオニル等のハロゲン化剤と反応させることにより、化合物 [25] を得ることが出来る。反応を促進させるために、DMF、ピリジン等の三級アミンの存在下若しくは加熱下で反応させてもよい。

## 第4工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [24] 又は [25] を、製法3-1と同様の方法で化合物 [I-2-8] と反応させることにより、化合物 [II-2-9] を得ることが出来る。

## 製法4-4



(式中、M' はマグネシウム、リチウム、亜鉛等の金属であり、各記号は前述の通りである。)

#### 第1工程

市販若しくは常法により得られる化合物 [41] を、常法によりアリール金属試薬とすることにより、化合物 [42] を得ることが出来る。

例えば、M' がマグネシウムの場合、マグネシウムをTHF、ジエチルエーテル、ベンゼン、トルエン等の溶媒中、好ましくはTHF溶媒中、冷却乃至加熱条件下、好ましくは-100乃至100℃で化合物 [41] と反応させることにより、化合物 [42] を得ることが出来る。

#### 第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [42] を化合物 [43] と反応させることにより、化合物 [44] を得ることが出来る。

化合物 [42] を、ジエチルエーテル、ベンゼン、トルエン、THF等の溶媒中、好ましくはTHF溶媒中、冷却乃至室温条件下、好ましくは-100乃至30℃で反応させることにより、化合物 [44] を得ることが出来る。

#### 第3工程

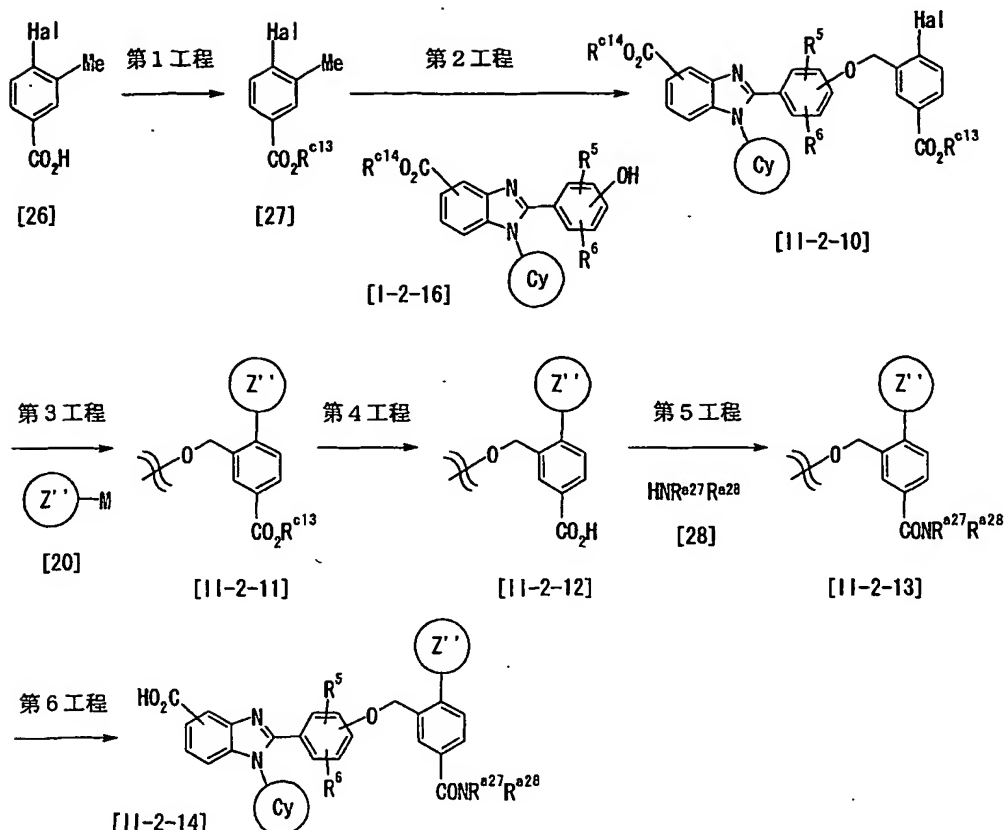
上記製法と同様にして得られる化合物 [44] を、製法4-3の第3工程と同様の方法でハロゲン化することにより、化合物 [45] を得ることが出来る。

化合物 [44] を、好ましくはトルエン溶媒中、塩化チオニル及びピリジンで反応させることにより化合物 [45] を得ることが出来る。

化合物 [45] が対称形の場合、すなわち、環B-(Z)<sub>w</sub>部分と環B'-(Z')<sub>w'</sub>部分が同一の場合、化合物 [42] を、ジエチルエーテル、ベンゼン、トルエン、THF等の溶媒中、好ましくはTHF溶媒中、ギ酸メチル、ギ酸エチル等のギ酸エステル、好ましくはギ酸エチルと、冷却乃至室温条件下、好ましくは-100乃至30℃で反応させることにより、化合物 [45] を得ることが出来る。

#### 製法4-5

官能基への保護基を導入する工程を含んだ方法。



(式中、 $R^{c13}$ はtert-ブチル基等のカルボン酸保護基であり、 $R^{c14}$ はメチル基等のカルボン酸保護基であり、その他各記号は前述の通りである。)

#### 第1工程

市販若しくは既知の方法により得られる化合物 [26] に常法により保護基を導入することにより、化合物 [27] を得ることが出来る。

例えば、 $R^{c13}$ がtert-ブチル基の場合、化合物 [26] を、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、トルエン等の溶媒中、塩化チオニル、塩化オキサリル等で誘導される酸ハライドとし、カリウムtert-ブトキシドと反応させることにより化合物 [27] を得ることが出来る。

ここで、 $R^{c13}$ は第2、第3工程によって脱離せず、また、第4工程によって $CO_2R^{c14}$ に影響を与えず脱離される保護基であれば他の保護基であってもよい。

#### 第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [27] のメチル基をN-プロモこはく酸イミド及びN,N'-アゾビスイソブチロニトリルでプロモメチル基に変換した後、

製法 3-1 と同様の方法で化合物 [I-2-16] と反応させることにより、化合物 [II-2-10] を得ることが出来る。

### 第 3 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-10] を、製法 4-1 と同様の方法でアリール金属化合物 [20] と反応させることにより、化合物 [II-2-11] を得ることが出来る。

### 第 4 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-11] の  $R^{c13}$  を、常法により脱離させることにより、化合物 [II-2-12] を得ることが出来る。

カルボン酸保護基の脱離は、保護基に応じた通常の脱保護法を用いればよいが、本工程では  $R^{c14}$  が反応しない条件が望ましい。例えば、 $R^{c13}$  が *tert*-ブチル基の場合、化合物 [II-2-11] を、ジクロロメタン、クロロホルム等の溶媒中、トリフルオロ酢酸で処理することにより化合物 [II-2-12] を得ることが出来る。

### 第 5 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-12] を、製法 1-1 の第 3 工程と同様の方法で化合物 [28] とアミド縮合させることにより、化合物 [II-2-13] を得ることが出来る。

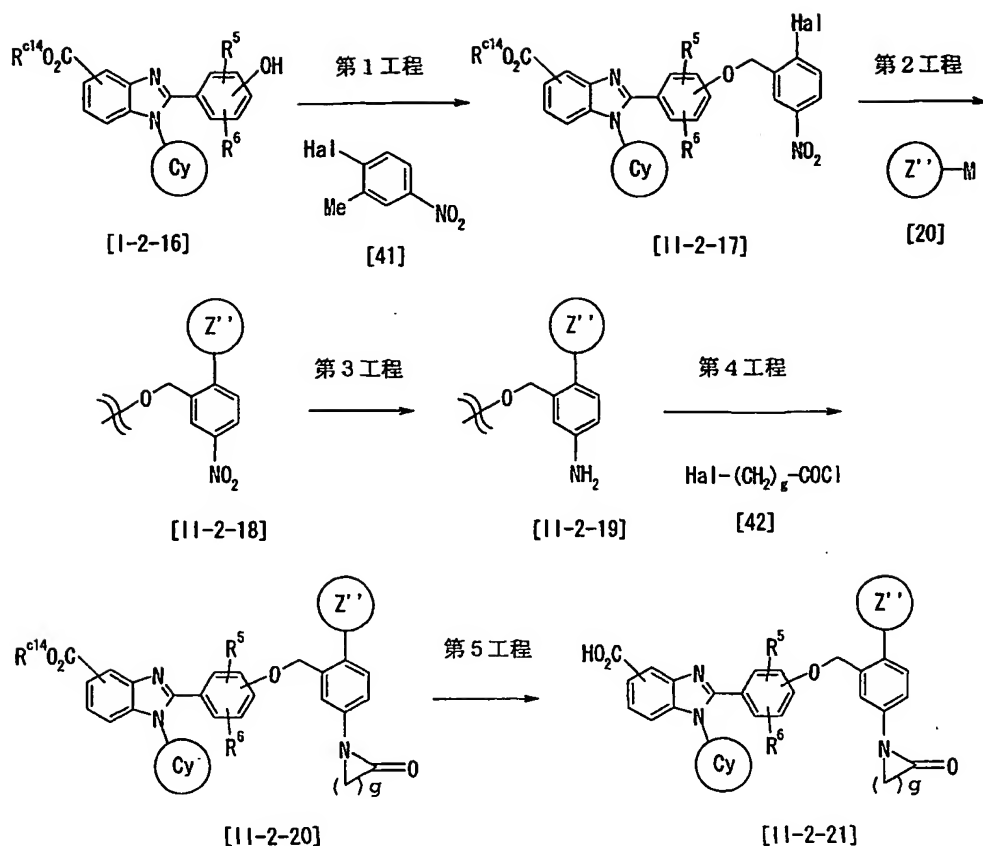
### 第 6 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-13] を、製法 2-1 の第 1 工程と同様の方法で脱保護させることにより、化合物 [II-2-14] を得ることが出来る。

ここで、 $R^{c14}$  は第 1 乃至 5 工程によって反応を示さず、本工程によって脱離される保護基が望ましい。

例えば、 $R^{c14}$  がメチル基のとき、化合物 [II-2-13] をメタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール等のアルコール溶媒若しくはアルコール溶媒と水との混合溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の塩基の存在下、冷却乃至加熱下で反応させ脱保護した後、溶液を酸性にすることにより化合物 [II-2-14] を得ることが出来る。

### 製法 4-6



(式中、 $g$  は 1 乃至 5 の整数であり、その他各記号は前記の通りである。)

#### 第1工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-16] を、製法 4-5 の第2工程と同様の方法でトルエン誘導体 [41] と反応させることにより、化合物 [II-2-17] を得ることが出来る。

#### 第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-17] を、製法 4-1 と同様の方法でアリール金属化合物 [20] と反応させることにより、化合物 [II-2-18] を得ることが出来る。

#### 第3工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-18] を、製法 1-1 の第2工程と同様の方法で還元することにより、化合物 [II-2-19] を得ることが出来る。

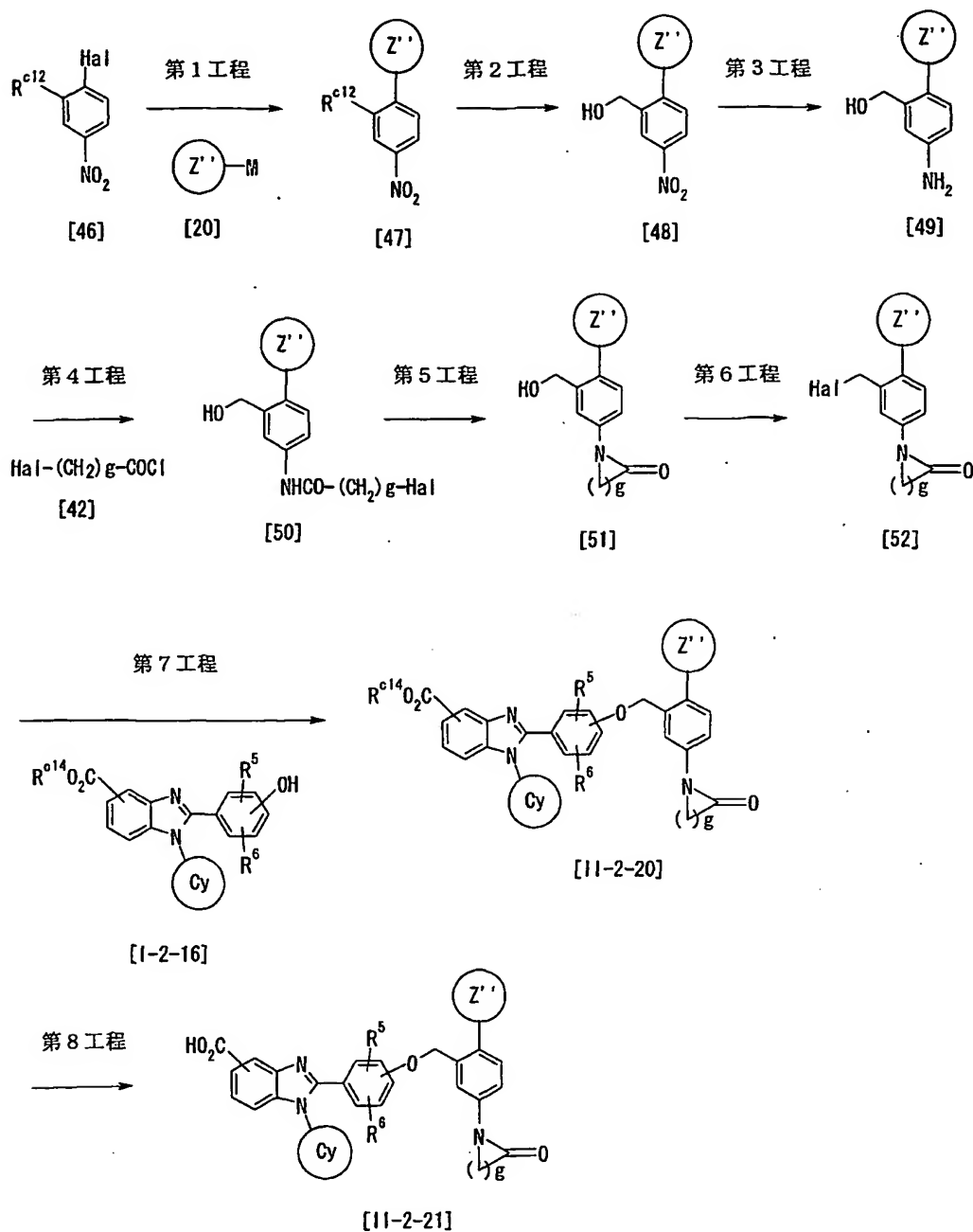
#### 第4工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-19] を、製法 1-1 の第 3 工程と同様の方法で化合物 [42] とアミド縮合させた後、製法 1-1 の第 1 工程と同様の方法で環化させることにより、化合物 [II-2-20] を得ることが出来る。

#### 第 5 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-20] を、製法 2-1 の第 1 工程と同様の方法で加水分解させることにより、化合物 [II-2-21] を得ることが出来る。

#### 製法 4-7



(式中、他各記号は前記の通りである。)

#### 第 1 工程

市販若しくは常法により得られる化合物 [46] を、製法 4-1 と同様の方法で化合物 [20] と反応させることにより、化合物 [47] を得ることが出来る。

#### 第 2 工程



上記製法と同様にして得られる化合物 [47] を、製法 4-3 の第 2 工程と同様の方法で還元することにより、化合物 [48] を得ることが出来る。

#### 第 3 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [48] を、製法 1-1 の第 2 工程と同様の方法で還元することにより、化合物 [49] を得ることが出来る。

#### 第 4 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [49] を、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、化合物 [42] と反応させることにより化合物 [50] を得ることが出来る。アミノ基への反応の選択性を高めるため、酢酸及び酢酸ナトリウムを当量比で加えてもよい。

#### 第 5 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [50] を、製法 1-1 の第 1 工程と同様の方法で環化反応させることにより、化合物 [51] を得ることが出来る。

#### 第 6 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [51] を、製法 4-3 の第 3 工程と同様の方法でハロゲン化することにより、化合物 [52] を得ることが出来る。

#### 第 7 工程

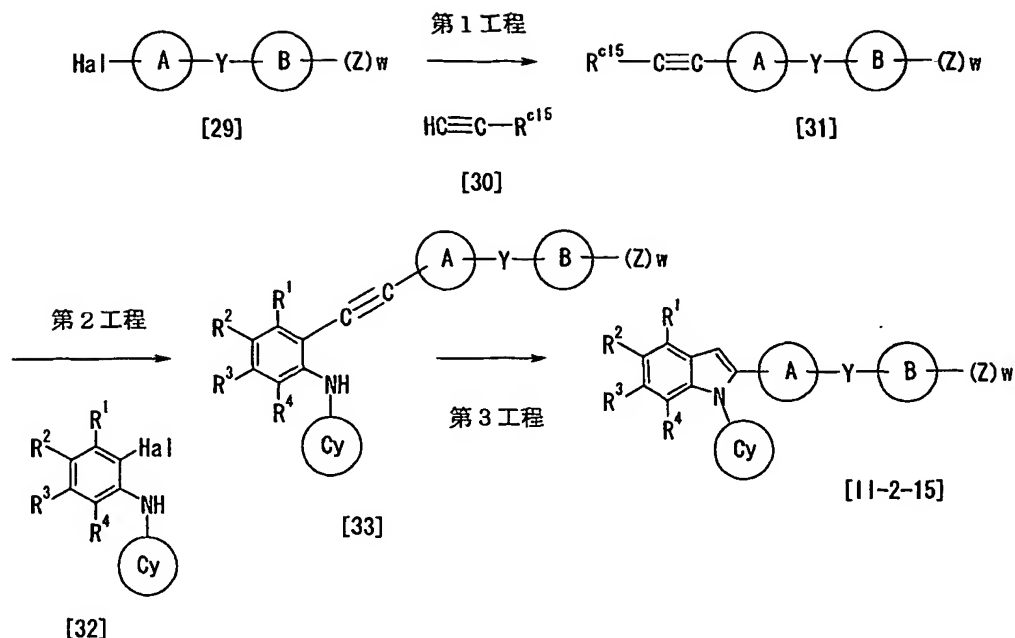
上記製法と同様にして得られる化合物 [52] を、製法 3-1 と同様の方法で、上記製法と同様にして得られる化合物 [I-2-16] と反応させることにより、化合物 [II-2-20] を得ることが出来る。

#### 第 8 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [II-2-20] を、製法 2-1 の第 1 工程と同様の方法で加水分解させることにより、化合物 [II-2-21] を得ることが出来る。

#### 製法 5

インドール環を形成する方法。



(式中、 $\text{R}^{c15}$ はトリメチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基、tert-ブチルジフェニルシリル基等の保護基であり、その他各記号は前述の通りである。)

#### 第1工程

上記製法若しくは常法により得られる化合物[29]を、DMF、アセトニトリル、1,2-ジメトキシエタン、THF、トルエン、水等の溶媒中、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド、酢酸パラジウム-トリフェニルホスフィン等のパラジウム触媒、ヨウ化銅(I)等の銅触媒若しくはそれらの混合物、及び炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、リン酸カリウム、トリエチルアミン等の塩基存在下、室温又は加熱条件で、化合物[30]と反応させることにより化合物[31]を得ることが出来る。

#### 第2工程

上記製法と同様にして得られる化合物[31]を、メタノール、エタノール等のアルコール溶媒、若しくはアルコール溶媒とDMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等との混合溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、

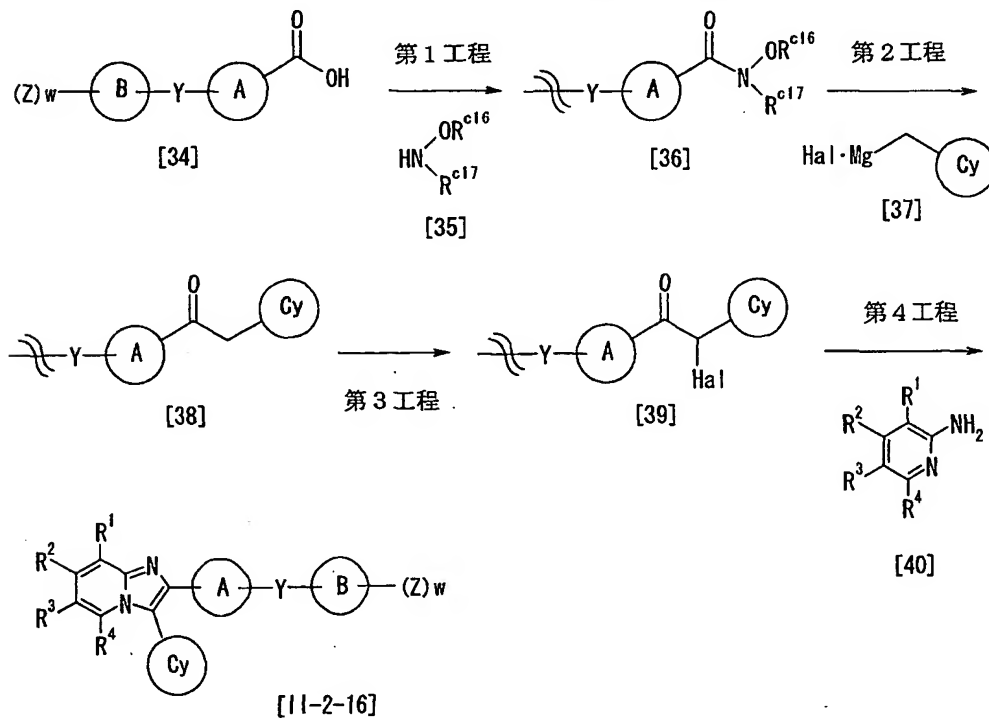
水酸化カリウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の塩基の存在下、室温若しくは加熱下で反応させることにより保護基の脱離を行った後、製法 1-1 の第 1 工程と同様にして得られる化合物 [32] と製法 5 の第 1 工程と同様の方法で反応させることにより、化合物 [33] を得ることが出来る。

### 第 3 工程

上記製法と同様にして得られる化合物 [33] を、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ヨウ化銅(I)等の銅触媒若しくは塩化パラジウム(II)等のパラジウム触媒の存在下、室温又は加熱条件下で、環化反応させることにより、化合物 [II-2-15] を得ることが出来る。

### 製法 6

イミダゾ [1, 2-a] ピリジン環を形成する方法。



(式中、 $R^{c16}$  及び  $R^{c17}$  は、それぞれ独立して、メチル基、エチル基等のアルキル基を示し、その他各記号は前述の通りである。)

### 第 1 工程

上記製法若しくは常法により得られる化合物 [34] を、製法 1-1 の第 3 工程

と同様の方法で化合物 [35] とアミド縮合させることにより、化合物 [36] を得ることが出来る。

#### 第2工程

上記製法により得られる化合物 [36] を、常法により得られるグリニャール試薬 [37] と反応させることにより、化合物 [38] を得ることが出来る。

ここで、化合物 [36] に代えて、化合物 [34] の酸ハライドを用いてもよい。

#### 第3工程

上記製法により得られる化合物 [38] を、常法によりハロゲン化することにより、化合物 [39] を得ることが出来る。

例えば、H a 1 が臭素原子の場合、化合物 [38] を冷却若しくは室温条件下、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、ジクロロメタン、酢酸エチル、トルエン等の溶媒中、臭素と反応させることにより化合物 [39] を得ることが出来る。

なお、臭素に代えて次亜塩素酸塩等の次亜ハロゲン酸塩、N-ブロモスクシンイミド等のハロゲン化剤を用いてハロゲン化することもできる。

#### 第4工程

上記製法により得られる化合物 [39] を、常法若しくは既知の方法（特開平8-48651号）により得られる化合物 [40] と、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の塩基の存在下、室温又は加熱条件下、溶媒中若しくは無溶媒で環化反応させることにより、化合物 [II-2-16] を得ることが出来る。

一般式 [I] 及び [II] で表される化合物において、既知文献に開示の方法と同様な方法により所望のヘテロ環基を形成することができる。以下に具体的なヘテロ環基の例及びその参考文献を記載する。

5-オキソ- $\Delta^2$ -1, 2, 4-オキサジアゾリン-3-イル基（すなわち2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル基）、5-オキソ- $\Delta^2$ -1, 2, 4-チアジアゾリン-3-イル基（すなわち2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル基）、2

ーオキソ $\Delta^3$ -1, 2, 3, 5-オキサチアゾアゾリン-4-イル基 (すなわち 2-オキソ $\Delta^3$ -1, 2, 4-オキサチアゾアゾル-4-イル基): Journal of Medicinal Chemistry, 39(26), 5228-35, 1996、

5-オキソ $\Delta^2$ -1, 2, 4-トリアゾリン-3-イル基: J Org Chem, 61(24), 8397-8401, 1996、

1-オキソ $\Delta^3$ -1, 2, 3, 5-チアトリアゾリン-4-イル基: Liebigs Ann Chem, 1376, 1980、

3-オキソ $\Delta^4$ -1, 2, 4-オキサジアゾリン-5-イル基: 欧州特許 E P 1 4 5 0 9 5 号、

5-オキソ $\Delta^2$ -1, 3, 4-オキサジアゾリン-2-イル基: J Org Chem, 20, 412, 1955、

5-オキソ $\Delta^3$ -1, 2, 4-ジオキサゾリン-3-イル基: J Prakt Chem, 314, 145, 1972、

3-オキソ $\Delta^4$ -1, 2, 4-チアジアゾリン-5-イル基: 特開昭 6 1 - 2 7 5 2 7 1 号、

5-オキソ $\Delta^3$ -1, 2, 4-ジチアゾリン-3-イル基: J Org Chem, 61(19), 6639-6645, 1996、

2-オキソ $\Delta^4$ -1, 3, 4-ジオキサゾリン-5-イル基: J Org Chem, 39, 2472, 1974、

2-オキソ $\Delta^4$ -1, 3, 4-オキサチアゾリン-5-イル基: J Med Chem, 35(20), 3691-98, 1992、

5-オキソ $\Delta^2$ -1, 3, 4-チアジアゾリン-2-イル基: J Prakt Chem, 332(1), 55, 1990、

5-オキソ $\Delta^2$ -1, 4, 2-オキサチアゾリン-3-イル基: J Org Chem, 31, 2417, 1966、

2-オキソ $\Delta^4$ -1, 3, 4-ジチアゾリン-5-イル基: Tetrahedron Lett, 23, 5453, 1982、

2-オキソ $\Delta^4$ -1, 3, 2, 4-ジオキサチアゾリン-5-イル基: Tetrahedron Lett, 319, 1968、

- 3, 5-ジオキソイソキサゾリジン-4-イル基: Helv Chim Acta, 1973, 48, 1965、
- 2, 5-ジオキソイミダゾリジン-4-イル基: Heterocycles, 43(1), 49-52, 1996、
- 5-オキソ-2-チオキソイミダゾリジン-4-イル基: Heterocycles, 5, 391, 1983、
- 2, 4-ジオキソオキサゾリジン-5-イル基: J Am Chem Soc, 73, 4752, 1951、
- 4-オキソ-2-チオキソオキサゾリジン-5-イル基: Chem Ber, 91, 300, 1958、
- 2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イル基: 特開昭57-123175号、
- 4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イル基: Chem Pharm Bull, 30, 3563, 1982、

上記製法2乃至4に示された製法は、一般式[I]及び[II]で表されるベンゾイミダゾール以外の化合物、例えば化合物[II-2-15]、[II-2-16]の合成にも用いることが出来る。

次に、本発明に係る一般式[I]、[II]、[III]で示される化合物、4-(4-フルオロフェニル)-5-ヒドロキシメチル-2-メチルチアゾール及び4-(4-フルオロフェニル)-5-クロロメチル-2-メチルチアゾール及びその製造方法を実施例によって具体的に説明する。しかしながら、本発明はこれら実施例によって限定されるものではない。

#### 実施例1

2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

工程1: 4-クロロ-3-ニトロ安息香酸エチルの製造

4-クロロ-3-ニトロ安息香酸(300g)をエチルアルコール(1500ml)に溶解し、氷冷下濃硫酸(100ml)を加え、7時間加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、析出した結晶を濾取し、表題化合物(332g, 収率97%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.50(1H, d, J=2.1Hz), 8.16(1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 7.63(1H, d, J=8.4Hz), 4.43(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)

## 工程 2 : 4-シクロヘキシルアミノ-3-ニトロ安息香酸エチルの製造

前工程で得られた4-クロロ-3-ニトロ安息香酸エチル(330g)をアセトニトリル(1500ml)に溶解し、シクロヘキシルアミン(220g)、トリエチルアミン(195g)を加え、終夜加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、析出した結晶を濾取し、表題化合物(400g, 収率94%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.87(1H, d,  $J=2.1\text{Hz}$ ), 8.35-8.46(1H, m), 8.02(1H, dd,  $J=9.1, 2.1\text{Hz}$ ), 6.87(1H, d,  $J=9.1\text{Hz}$ ), 4.35(2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 3.65-3.50(1H, m), 2.14-1.29(10H, m), 1.38(3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

## 工程 3 : 3-アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチルの製造

前工程で得られた4-シクロヘキシルアミノ-3-ニトロ安息香酸エチル(400g)を酢酸エチル(1500ml)、エチルアルコール(500ml)に溶解し、7.5%パラジウム炭素(50% wet, 40g)を加え、7時間常圧水素添加した。触媒を濾別し、濾液を減圧濃縮した。残渣にジイソプロピルエーテルを加え、析出した結晶を濾取し、表題化合物(289g, 収率80%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 7.57(1H, dd,  $J=8.4, 1.9\text{Hz}$ ), 7.41(1H, d,  $J=1.9\text{Hz}$ ), 6.59(1H, d,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 4.30(2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 3.40-3.30(1H, m), 2.18-2.02(2H, m), 1.88-1.15(8H, m), 1.35(3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

## 工程 4 : 3-[4-(3-ブロモフェノキシ)ベンゾイル]アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチルエステルの製造

4-(3-ブロモフェノキシ)安息香酸(74g)をクロロホルム(500ml)に溶解し、塩化オキサリル(33ml)及びジメチルホルムアミド(触媒量)を加え室温で4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、ジクロロメタン(150ml)に溶解した。これを、前工程で得られた3-アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチル(66g)のジクロロメタン(500ml)、トリエチルアミン(71ml)溶液に滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出した。有機層を、飽和食塩水で洗浄して、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣に、ジエチルエーテルを加えて結晶化し、これを濾取して表題化合物(129g, 収率95%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.00-7.78(4H, m), 7.66(1H, brs), 7.37-7.18(3H, m), 7.13

-6.59 (3H, m), 6.72 (1H, d, J=8.7Hz), 4.50 (1H, brs), 4.29 (2H, q, J=7.2Hz), 3.36 (1H, m), 2.12-1.96 (2H, m), 1.83-1.56 (3H, m), 1.47-1.12 (5H, m), 1.37 (3H, t, J=7.2Hz)

工程5: 2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

前工程で得られた3-[4-(3-ブロモフェノキシ)ベンゾイル]アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチルエステル(129g)を酢酸(600ml)に懸濁し、3時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮して、残渣に水を加え、析出した結晶を濾取し表題化合物(124g, 収率99%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.51 (1H, d, J=1.5Hz), 8.00 (1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.67 (1H, d, J=8.4Hz), 7.63 (2H, d, J=8.7Hz), 7.35-7.21 (3H, m), 7.17 (2H, d, J=8.7Hz), 7.14 (1H, m), 4.42 (2H, q, J=7.2Hz), 4.38 (1H, m), 2.43-2.22 (2H, m), 2.07-1.87 (4H, m), 1.80 (1H, m), 1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 1.40-1.27 (3H, m)

#### 実施例2

2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例1で得られた2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル(1.0g)をテトラヒドロフラン(10ml)、エチルアルコール(10ml)に溶解し、4N水酸化ナトリウム(10ml)を加え、1時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加え、6N塩酸で酸性にし、析出した結晶を濾取して、表題化合物(0.9g, 収率96%)を得た。

融点: 255-256°C

FAB-MS: 491 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR(300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 12.75 (1H, brs), 8.24 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.7Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.71 (2H, d, J=8.6Hz), 7.47-7.34 (3H, m), 7.24 (2H, d, J=8.6Hz), 7.20 (1H, m), 4.31 (1H, m), 2.38-2.18 (2H, m), 2.02-1.79 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.44-1.20 (3H, m)

#### 実施例3

1-シクロヘキシル-2-(4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-



### 5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例1の工程3で得られた3-アミノ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸エチル (130g)、メチル 4-ヒドロキシベンズイミデート塩酸塩 (139g) をメチルアルコール (1500ml) に加え、4時間加熱還流した。反応液を放冷した後、析出した結晶を濾取し表題化合物 (131g, 収率 72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 10.02 (1H, brs), 8.21 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.93 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.83 (1H, dd,  $J=8.6, 1.4\text{Hz}$ ), 7.48 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 6.95 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 4.39-4.25 (1H, m), 4.33 (1H, q,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 2.35-2.18 (2H, m), 1.98-1.79 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.46-1.19 (3H, m), 1.35 (3H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ )

### 実施例4

2- [4- (2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

2-ブロモ-5-クロロトルエン (50g) 及びN-ブロモコハク酸イミド、N, N'-アゾビスイソブチロニトリルより調製した2-ブロモ-5-クロロベンジルブロミド及び、実施例3で得られた1-シクロヘキシル-2- (4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (50g) をジメチルホルミアミド (300ml) に懸濁し、炭酸カリウム (38g) を加え  $80^\circ\text{C}$  にて1時間加熱攪拌した。反応液を放冷し、水、酢酸エチル混合溶媒に加え、析出した結晶を濾取し、表題化合物 (50g, 収率 64%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.50 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, dd,  $J=8.6, 1.4\text{Hz}$ ), 7.70-7.57 (5H, m), 7.20 (1H, dd,  $J=8.4, 2.5\text{Hz}$ ), 7.14 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 5.17 (2H, s), 4.46-4.30 (1H, m), 4.41 (2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 2.40-2.20 (2H, m), 2.02-1.21 (8H, m), 1.42 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

### 実施例5

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例4で得られた2- [4- (2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエス

テル (49g)、4-クロロフェニルボロン酸 (18g) 及びテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (10g) を 1, 2-ジメトキシエタン (600ml) に懸濁し、飽和重曹水 (300ml) を加え、2 時間加熱還流した。反応液にクロロホルムを加え、有機層を飽和重曹水、水、飽和食塩水にて順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 クロロホルム:酢酸エチル=97:3) で精製した。得られた油状物に、酢酸エチル及びジイソプロピルエーテルを加え、結晶化し、これを濾取して表題化合物 (44g, 収率 85%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.49 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, dd,  $J=8.6, 1.6\text{Hz}$ ), 7.70-7.60 (2H, m), 7.55 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 4.95 (2H, s), 4.48-4.28 (1H, m), 4.40 (2H, m), 2.02-1.20 (8H, m), 1.41 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

#### 実施例 6

2- { 4- [ 2- ( 4-クロロフェニル) - 5-クロロベンジルオキシ] フェニル } - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 5 で得られた 2- { 4- [ 2- ( 4-クロロフェニル) - 5-クロロベンジルオキシ] フェニル } - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (43g) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (33g, 収率 76%) を得た。

融点: 243-244°C

FAB- $\text{Ms}$ : 571 ( $\text{MH}^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ): 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, d,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 8.05 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.76-7.72 (3H, m), 7.58-7.46 (5H, m), 7.40 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.24 (2H, d,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 5.11 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m)

#### 実施例 7

2- [ 4- ( 2-ブromo-5-メトキシベンジルオキシ) フェニル ] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 4 と同様にして、実施例 3 で得られた 1-シクロヘキシル-2- ( 4-ヒドロキシフェニル ) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルと 2

ーブロモー５－メトキシベンジルブロミドから表題化合物（59g）を得た。

#### 実施例 8

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]フェニル}－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 7 で得られた 2－[4－（2－ブロモー５－メトキシベンジルオキシ）フェニル]－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸エチルエステルから実施例 5 と同様の方法により表題化合物（48g，収率 77%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.49 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, dd,  $J=8.6, 1.4\text{Hz}$ ), 7.64 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.54 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.37 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.31 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.25 (1H, d,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 7.19 (1H, d,  $J=2.7\text{Hz}$ ), 7.00 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 6.97 (1H, dd,  $J=8.4, 2.7\text{Hz}$ ), 4.98 (2H, s), 4.41 (2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 4.42-4.29 (1H, m), 3.88 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 2.01-1.88 (4H, m), 1.83-1.73 (1H, m), 1.42 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 1.41-1.25 (3H, m)

#### 実施例 9

2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]フェニル}－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸の製造

実施例 8 で得られた 2－{4－[2－（4－クロロフェニル）－5－メトキシベンジルオキシ]フェニル}－1－シクロヘキシルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸エチルエステル（52g）を用い、実施例 2 と同様の方法により表題化合物（44g，収率 89%）を得た。

融点: 248-249°C

FAB- $\text{Ms}$ : 568 ( $\text{MH}^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ): 8.20 (1H, s), 7.88 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.85 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.57 (d, 2H,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.46 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.44 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.29 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.24 (1H, d,  $J=2.6\text{Hz}$ ), 7.11 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.06 (1H, dd,  $J=8.5, 2.6\text{Hz}$ ), 5.04 (2H, s), 4.26 (1H, m), 3.83 (3H, s), 2.38-2.29 (2H, m)

#### 実施例 10

1－シクロヘキシル－2－{4－[(E)－2－フェニルビニル]フェニル}ベ

### ンゾイミダゾールー 5 - カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 1 の工程 3 で得られた 3 - アミノ - 4 - シクロヘキシルアミノ安息香酸エチル (500mg) をメチルアルコール (6ml) に溶解し、氷冷下、トランス - 4 - スチルベンカルボアルデヒド (397mg) を加え、室温にて終夜攪拌した。反応液を氷冷し、アセトニトリル (2ml) に溶解したベンゾフロキサン (259mg) を加え、50℃にて 7 時間攪拌した。反応液を氷冷し、1 N 水酸化ナトリウム (0.1ml) を加えた後、酢酸エチルを加えて抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 4 : 1) で精製し、表題化合物 (540mg, 収率 63%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : 8.28 (1H, d, J=1.4Hz), 8.01 (1H, d, J=8.7Hz), 7.90-7.80 (3H, m), 7.75-7.65 (4H, m), 7.50-7.25 (5H, m), 4.35 (2H, q, J=7.0Hz), 4.31 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.63 (1H, m), 1.40-1.20 (3H, m), 1.36 (3H, t, J=7.0Hz)

### 実施例 1 1

1 - シクロヘキシルー 2 - { 4 - [(E) - 2 - フェニルビニル] フェニル } ベンゾイミダゾールー 5 - カルボン酸の製造

実施例 1 0 で得られた 1 - シクロヘキシルー 2 - { 4 - [(E) - 2 - フェニルビニル] フェニル } ベンゾイミダゾールー 5 - カルボン酸エチルエステル (127mg) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (116mg, 収率 97%) を得た。

融点 : 300℃以上

FAB-MS: 423 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : 8.25 (1H, s), 7.96-7.29 (13H, m), 4.33 (1H, brt), 2.41-2.23 (2H, m), 2.03-1.78 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.49-1.20 (3H, m)

### 実施例 1 2

2 - ( 4 - ベンジルオキシフェニル ) - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾールー 5 - カルボン酸の製造

実施例 1 及び 2 と同様にして表題化合物 (700mg) を得た。

FAB-MS: 413 (MH<sup>+</sup>)

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.60 (1H, s), 8.04 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.63 (2H, d,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 7.51-7.32 (6H, m), 7.14 (2H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 5.16 (2H, s), 5.03-4.89 (1H, m), 2.41-1.63 (8H, m)

### 実施例 1 3

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミドの製造

実施例 1 2 で得られた 2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 (700mg) をジメチルホルムアミド (10ml) に溶解し、塩化アンモニウム (108mg)、1-エチル-3- (3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 (390mg)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (275mg) 及びトリエチルアミン (0.3ml) を加え室温にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、水、飽和食塩水にて順次洗浄して、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣に、酢酸エチル及びジイソプロピルエーテルを加え、結晶化し、これを濾取して、表題化合物 (571mg, 収率 81%) を得た。

融点: 232-233°C

FAB-MS: 412 (MH<sup>+</sup>)

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.23 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.86 (1H, dd,  $J=8.5, 1.5\text{Hz}$ ), 7.65-7.30 (8H, m), 7.13 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 5.16 (2H, s), 4.93 (1H, quint,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 2.40-1.60 (8H, m)

### 実施例 1 4

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 5-シアノ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾールの製造

実施例 1 と同様にして表題化合物 (400mg) を得た。

FAB-MS: 394 (MH<sup>+</sup>)

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.11 (1H, s), 7.68-7.30 (9H, m), 7.13 (2H, s), 5.16 (2H, s), 4.94 (1H, quint,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 2.35-1.60 (8H, m)

### 実施例 1 5

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール

# ルー 5 - カルボキサミドオキシムの製造

実施例 14 で得られた 2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 5 - シアノ - 1 - シクロペンチルベンゾイミダゾール (400mg) をエチルアルコール (3ml)、水 (1.5ml) に懸濁し、ヒドロキシルアミン塩酸塩 (141mg) 及び重曹 (170mg) を加え、終夜加熱還流した。反応液を、放冷し析出した結晶を濾取して、表題化合物 (312mg, 収率 71%) を得た。

融点: 225-226°C

FAB-MS: 456 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 8.20 (1H, s), 7.50-7.31 (9H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.61 (3H, s), 3.40 (3H, s), 2.41-1.42 (8H, m)

## 実施例 16

1 - シクロヘキシル - 2 - {4 - [{4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 5 - チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1: 4 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシメチル - 2 - メチルチアゾールの製造

文献既知 (Chem. Pharm. Bull., 43(6), 947, 1995) の方法により調製した 4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 5 - チアゾールカルボン酸エチルエステル (59g) をテトラヒドロフラン (700ml) に溶解し、氷冷下、水素化リチウムアルミニウム (13g) を加え 30 分攪拌した。反応液に水 (13ml)、15% 水酸化ナトリウム (13ml)、水 (39ml) を順次加え、析出した不溶物を濾別した。濾液を減圧濃縮し、表題化合物 (37g, 収率 71%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 7.60 (2H, dd, J=8.7, 6.6Hz), 7.11 (2H, t, J=8.7Hz), 4.80 (2H, s), 2.70 (3H, s)

工程 2: 5 - クロロメチル - 4 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチルチアゾールの製造

前工程で得られた 4 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシメチル - 2 - メチルチアゾール (37g) をクロロホルム (500ml) に溶解し、塩化チオニル (24ml)、ピリジン (2ml) を加え、室温で 3 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、クロロホ

ルムで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄した。これを、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して表題化合物 (29g, 収率 76%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 7.67 (2H, dd,  $J=8.8, 5.4\text{Hz}$ ), 7.16 (2H, t,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 4.79 (2H, s), 2.73 (3H, s)

工程 3 : 1-シクロヘキシル-2- { 4- [ { 4- (4-フルオロフェニル) - 4-メチル-5-チアゾリル } メトキシ ] フェニル } ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

前工程で得られた 5-クロロメチル-4- (4-フルオロフェニル) -2-メチルチアゾール (28g) 及び実施例 3 で得られた 1-シクロヘキシル-2- (4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (36g) を用い、実施例 4 と同様の方法により表題化合物 (61g, 収率 100%) を得た。

APCI- $\text{Ms}$ : 570 ( $\text{MH}^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ) : 8.25 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.86 (1H, d,  $J=8.6, 1.6\text{Hz}$ ), 7.74 (2H, dd,  $J=8.8, 5.5\text{Hz}$ ), 7.62 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.33 (2H, t,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 7.22 (2H, t,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 5.41 (2H, s), 4.34 (2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 4.31 (1H, m), 2.71 (3H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.55-1.15 (3H, m), 1.36 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

#### 実施例 17

1-シクロヘキシル-2- { 4- [ { 4- (4-フルオロフェニル) - 2-メチル-5-チアゾリル } メトキシ ] フェニル } ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸

実施例 16 で得られた 1-シクロヘキシル-2- { 4- [ { 4- (4-フルオロフェニル) - 4-メチル-5-チアゾリル } メトキシ ] フェニル } ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (60g) を用い、実施例 2 と同様の方法により表題化合物 (39g, 収率 69%) を得た。

融点: 196-198°C

FAB- $\text{Ms}$ : 542 ( $\text{MH}^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ) : 13.1 (1H, brs), 8.34 (1H, s), 8.29 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.06 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.80-7.72 (4H, m), 7.36-7.31 (4H, m), 5.46 (2H, s), 4.38 (1H, m), 2.72 (3H, s), 2.45-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m),

1. 55-1. 20 (3H, m)

#### 実施例 18

1-シクロヘキシル-2-(2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 3 と同様にして表題化合物 (50g) を得た。

#### 実施例 19

2-{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1 : 3, 3'-ジフルオロベンズヒドロールの製造

マグネシウム片 (35.4g) の THF (200ml) 混合液にヨウ素片を加え、窒素気流攪拌下、ヨウ素の色がほぼ消えるまで加熱した。この溶液を内温 60℃ に維持しながら、3-フルオロプロモベンゼン (250.0g) の THF (1000ml) 溶液を 2.5 時間で滴下した。滴下終了後、1 時間加熱還流した。得られたグリニャール溶液を氷冷し、ギ酸エチル (63.2g) の THF (200ml) 溶液を 1 時間かけて滴下した。更に反応溶液を 30 分攪拌後、飽和塩化アンモニウム水溶液 (700ml) を氷冷攪拌下滴下し、水 (300ml) を加え、10 分攪拌した。有機層と水層を分離し、水層を酢酸エチルで抽出し、有機層を合わせて 2 N 塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去し、目的化合物 (156.2g、収率 99%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 7.31 (2H, td, J=7.9, 5.8Hz), 7.15-7.80 (4H, m), 6.97-6.94 (2H, m), 5.82 (1H, d, J=3.3Hz), 2.30 (1H, d, J=3.3Hz)

工程 2 : 3, 3'-ジフルオロベンズヒドリクロリドの製造

前工程で得られた 3, 3'-ジフルオロベンズヒドロール (150.0g) のトルエン溶液 (400ml) に、室温でピリジン (539mg) を加えた。この溶液に塩化チオニル (89.1g) を室温で 1 時間かけ滴下し、更に 2 時間攪拌した。内温が 40℃ になるように加熱し、更に 1.5 時間攪拌した。塩化チオニル (8.1g) を再度加え、30 分攪拌した。反応液に水を加え、有機層を分離し、これを水、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧



留去し、表題化合物 (158.2g, 収率 97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 7.32 (2H, td,  $J=8.0, 5.9\text{Hz}$ ), 7.18-7.10 (4H, m), 7.01 (2H, t,  $J=8.2, 2.5, 1.2\text{Hz}$ ), 6.05 (1H, s)

工程 3 : 2- { 4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 18 で得られた 1-シクロヘキシル-2- (2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (50g) 及び前工程により得られた 3, 3'-ジフルオロベンズヒドリルクロリド (34g) を用い、実施例 4 と同様の方法により、表題化合物 (76 g, 収率 99%) を得た。

FAB- $\text{Ms}$ : 585 (MH $^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ): 8.24 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.98 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.88 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.56 (1H, t,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.50-7.40 (6H, m), 6.82 (1H, s), 4.34 (2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 3.95 (1H, m), 2.20-2.10 (2H, m), 1.90-1.80 (4H, m), 1.6 (1H, m), 1.35 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 1.30-1.20 (3H, m)

実施例 20

2- { 4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 19 で得られた 2- { 4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (75g) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (48g, 収率 62%) を得た。

融点: 242-243 $^{\circ}\text{C}$

FAB- $\text{Ms}$ : 557 (MH $^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ): 8.29 (1H, s), 8.16 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.99 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.66 (1H, t,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.51-7.40 (6H, m), 7.30 (1H, d,  $J=12.1\text{Hz}$ ), 7.20-7.14 (3H, m), 6.88 (1H, s), 4.07 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)

実施例 21

1-シクロペンチル-2-(4-ニトロフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル

実施例 1 と同様にして表題化合物 (12g) を得た。

実施例 2 2

2-(4-アミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 2 1 で得られた 1-シクロペンチル-2-(4-ニトロフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (12g) をテトラヒドロフラン (200ml)、エチルアルコール (50ml) に溶解し、7.5%パラジウム炭素 (50% wet, 1g) を加え、1 時間常圧水素添加した。触媒を濾別し、濾液を減圧濃縮した。残渣にテトラヒドロフランを加え結晶化し、これを濾取して、表題化合物 (11g, 収率 98%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.49 (1H, d,  $J=1.3\text{Hz}$ ), 7.95 (1H, dd,  $J=8.5, 1.3\text{Hz}$ ), 7.50-7.40 (3H, m), 6.79 (2H, d,  $J=4.6\text{Hz}$ ), 4.97 (1H, quint,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 4.40 (2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 3.74 (2H, brs), 2.40-1.60 (8H, m), 1.41 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

実施例 2 3

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 2 2 で得られた 1-シクロペンチル-2-(4-アミノフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (300mg) をピリジン (3ml)、クロロホルム (3ml) に溶解し、塩化ベンゾイル (127mg) を加え、室温にて 30 分攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加えて結晶化した。これを濾取して表題化合物 (403mg, 収率 100%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.58 (1H, s), 8.00 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.84 (2H, d,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 7.60-7.40 (6H, m), 7.14 (2H, d,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 4.84 (1H, quint,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 4.41 (2H, q,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 2.20-1.30 (8H, m), 1.41 (3H, t,  $J=7.5\text{Hz}$ )

実施例 2 4

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 23 で得られた 2- (4-ベンゾイルアミノフェニル) -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (200mg) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表記化合物 (131mg, 収率 70%) を得た。

融点: 300°C 以上

FAB-MS: 426 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 10.75 (1H, s), 8.35 (1H, s), 8.15 and 7.85 (4H, ABq, J=8.9 Hz), 8.10-7.98 (4H, m), 7.70-7.55 (3H, m), 5.02 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.36-2.15 (4H, m), 2.14-1.95 (2H, m), 1.80-1.62 (2H, m)

#### 実施例 25

2- {4- [3- (3-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 1 で得られた 2- [4- (3-ブロモフェノキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (65g) 及び 3-クロロフェニルボロン酸 (23g) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表記化合物 (59g, 収率 85%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.51 (1H, d, J=1.8Hz), 7.99 (1H, dd, J=8.7, 1.8Hz), 7.71-7.55 (4H, m), 7.51-7.43 (2H, m), 7.43-7.27 (4H, m), 7.19 (1H, d, J=8.4Hz), 7.12 (1H, m), 4.41 (2H, q, J=7.2Hz), 4.39 (1H, m), 2.42-2.22 (2H, m), 2.03-1.87 (4H, m), 1.79 (1H, m), 1.42 (3H, t, J=7.2Hz), 1.39-1.29 (3H, m)

#### 実施例 26

2- {4- [3- (3-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 25 で得られた 2- {4- [3- (3-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (59g) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表記化合物 (43g, 収率 76%) を得た。

融点: 253-254°C

FAB-MS: 523 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 12.82 (1H, brs), 8.24 (1H, d, J=1.3Hz), 7.98 (1H, d, J=8.

7Hz), 7.89(1H, dd, J=8.7, 1.3Hz), 7.78(1H, s), 7.72(2H, d, J=9.7Hz), 7.70(1H, m), 7.64-7.42(5H, m), 7.25(2H, d, J=8.7Hz), 7.20(1H, m), 4.33(1H, m), 2.39-2.17(2H, m), 2.00-1.76(4H, m), 1.65(1H, m), 1.50-1.22(3H, m)

#### 実施例 27

2-[4-(3-アセトキシフェニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 1 と同様にして表題化合物 (87g) を得た。

#### 実施例 28

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェニルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 27 で得られた 2-[4-(3-アセトキシフェニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (87g) をメチルアルコール (250ml)、テトラヒドロフラン (250ml) に溶解し、炭酸カリウム (31g) を加え、室温にて 30 分攪拌した。不溶物を濾別し、濾液を減圧濃縮した。残渣に水を加え、2N 塩酸で中和し、析出した結晶を濾取して表題化合物 (78g, 収率 97%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 9.71(1H, s), 7.98(1H, d, J=8.7Hz), 7.87(1H, d, J=8.7Hz), 7.68(2H, d, J=8.6Hz), 7.24(1H, t, J=8.1Hz), 7.18(2H, d, J=8.6Hz), 6.63(1H, d, J=8.1Hz), 6.57(1H, d, J=8.1Hz), 6.51(1H, s), 4.38-4.23(1H, m), 4.35(2H, q, J=6.9Hz), 2.36-2.18(2H, m), 1.99-1.78(4H, m), 1.71-1.59(1H, m), 1.45-1.20(3H, m), 1.36(3H, t, J=6.9Hz)

#### 実施例 29

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピリジルメトキシ)フェニルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例 28 で得られた 1-シクロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェニルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (78g) をジメチルホルムアミド (800ml) に懸濁し、氷冷下、水素化ナトリウム (60%油性、14g) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。反応液を氷冷し、4-クロロメチルピリジン塩酸塩 (29g) を加え 30 分攪拌した後、室温で終夜攪拌した。

反応液に水を加え、析出した結晶を濾取した。これをエチルアルコールより再結晶して、表題化合物 (77g, 収率 82%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.63 (2H, d, J=6.0Hz), 8.51 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.66 (2H, d, J=8.7Hz), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz), 7.36 (2H, d, J=8.7Hz), 7.31 (1H, t, J=8.2Hz), 7.26 (1H, s), 7.16 (2H, d, J=8.7Hz), 6.79-6.70 (3H, m), 5.09 (2H, s), 4.47-4.31 (1H, m), 4.42 (2H, q, J=7.0Hz), 2.42-2.22 (2H, m), 2.04-1.71 (5H, m), 1.45-1.25 (3H, m), 1.42 (3H, t, J=7.0Hz)

### 実施例 30

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピリジルメトキシ)フェニルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸の製造

実施例 29 で得られた 1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピリジルメトキシ)フェニルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル (60g) を用い、実施例 2 と同様の方法により表題化合物 (54g, 収率 75%) を得た。

融点: 235-237°C

FAB-MS: 520 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 8.58 (2H, d, J=6.0Hz), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, AB q, J=8.7Hz), 7.68 and 7.17 (4H, A'B' q, J=8.7Hz), 7.44 (2H, d, J=8.7Hz), 7.39 (1H, t, J=8.3Hz), 6.90 (1H, d, J=8.1Hz), 6.84 (1H, s), 6.75 (1H, d, J=8.1Hz), 5.22 (2H, s), 4.40-4.22 (1H, m), 2.40-2.19 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m)

### 実施例 241

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

工程 1: 2-プロモ-5-メトキシベンズアルデヒドの製造

3-メトキシベンズアルデヒド (15g) を酢酸 (75ml) に溶解し、酢酸 (15ml) に溶解した臭素 (5.7ml) を滴下し、室温で終夜攪拌した。反応液に水 (150ml) を加え、析出した結晶を濾取、水洗、減圧乾燥し、表題化合物 (21g, 収率 88%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 10.31 (1H, s), 7.52 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.41 (1H, d,  $J=3.3\text{Hz}$ ), 7.03 (1H, dd,  $J=8.8, 3.3\text{Hz}$ ), 3.48 (3H, s)

工程 2: 2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンズアルデヒドの製造  
前工程で得られた 2-ブロモ-5-メトキシベンズアルデヒド (10g) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表題化合物 (11g, 収率 96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 9.92 (1H, s), 7.50 (1H, d,  $J=2.6\text{Hz}$ ), 7.48-7.14 (6H, m), 3.90 (3H, s)

工程 3: 2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルアルコールの製造

前工程で得られた 2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンズアルデヒド (10g) をテトラヒドロフラン (30ml) に溶解し、これを水素化ホウ素ナトリウム (620mg) をイソプロピルアルコール (50ml) に懸濁したものに滴下し、1 時間攪拌した。溶媒を減圧留去し、残渣に水を加え析出した結晶を濾取して減圧乾燥した。これを、メタノールと水の混合液より再結晶して表題化合物 (9.2g, 収率 91%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 7.37 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.27 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.17 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.11 (1H, d,  $J=2.6\text{Hz}$ ), 6.89 (1H, dd,  $J=8.6, 2.6\text{Hz}$ ), 4.57 (2H, s), 3.86 (3H, s)

工程 4: 2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルクロリドの製造  
前工程で得られた 2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルアルコール (20g) を酢酸エチル (100ml)、ピリジン (0.5ml) に溶解し、塩化チオニル (11ml) を滴下し 1 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和重曹水、水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。残渣にイソプロピルアルコールを加え結晶化し、これを濾取、減圧乾燥し、表題化合物 (16g, 収率 74%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 7.43-7.29 (4H, m), 7.17 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.05 (1H, d,  $J=2.6\text{Hz}$ ), 6.96-6.89 (1H, m), 4.46 (2H, s), 3.86 (3H, s)

工程 5: 2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルクロリド (4.0g)、実施例 3 と同様にして得られた 1-シクロヘキシル-2- (4-ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (5.0g) を用い実施例 4 と同様の方法により、表題化合物 (6.0g, 収率 72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.48 (1H, s), 8.00-7.93 (1H, m), 7.68-7.62 (1H, m), 7.54 (2H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.41-7.16 (6H, m), 7.04-6.93 (3H, m), 4.97 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.94 (3H, s), 3.87 (3H, s), 2.39-2.21 (2H, m), 2.02-1.88 (4H, m), 1.85-1.45 (4H, m)

#### 実施例 2 4 2

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩の製造

実施例 2 4 1 で得られた 2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (5.0g) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (5.1g, 収率 98%) を得た。

APCI- $\text{Ms}$ : 568 ( $\text{MH}^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ): 8.30 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 8.24 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 8.03 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.72 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.51-7.39 (4H, m), 7.34-7.18 (4H, m), 7.11-7.03 (1H, m), 5.08 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.83 (3H, m), 2.40-2.18 (2H, m), 2.10-1.96 (2H, m), 1.93-1.78 (2H, m), 1.72-1.18 (4H, m)

#### 実施例 2 4 3

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-イルメトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1: 3-ヒドロキシピコリン酸メチルエステルの製造

3-ヒドロキシピコリン酸 (1.0g) をメタノール (10ml) に懸濁し、濃硫酸 (1.0ml) を加え、5 時間加熱還流した。反応液を氷冷し、飽和重曹水を加え中和した後、クロロホルムで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (711mg, 収率 64%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 10.63 (1H, s), 8.28 (1H, dd,  $J=3.7, 1.8\text{Hz}$ ), 7.47–7.35 (2H, m), 4.06 (3H, s)

工程 2: 3- (トリフルオロメチルスルホニルオキシ) ピリジン-2-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 3-ヒドロキシピコリン酸メチルエステル (710mg)、トリエチルアミン (0.77ml) をジクロロメタン (7ml) に溶解し、氷冷下、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 (0.86ml) を加えた。反応液を室温に戻し、2 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄して、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (1.2g, 収率 90%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.80–8.73 (1H, m), 7.75–7.70 (1H, m), 7.63 (1H, dd,  $J=8.2, 4.5\text{Hz}$ ), 4.05 (3H, s)

工程 3: 3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 3- (トリフルオロメチルスルホニルオキシ) ピリジン-2-カルボン酸メチルエステル (1.2g) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表題化合物 (728mg, 収率 69%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.73–8.66 (1H, m), 7.77–7.68 (1H, m), 7.49 (1H, dd,  $J=7.8, 4.5\text{Hz}$ ), 7.46–7.37 (2H, m), 7.32–7.23 (2H, m), 3.80 (3H, s)

工程 4: [3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-イル] メタノールの製造

前工程で得られた 3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-カルボン酸メチルエステル (720mg) をテトラヒドロフラン (10ml) に溶解し氷冷した。これに水素化リチウムアルミニウム (160mg) を加え、1 時間攪拌した。反応液に、水 (1.6ml)、15%水酸化ナトリウム (1.6ml)、水 (4.8ml) を順次加え、不溶物を濾別して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) で精製して、表題化合物 (208mg, 収率 32%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.60 (1H, dd,  $J=4.8, 1.5\text{Hz}$ ), 7.60–7.55 (1H, m), 7.40–7.48 (2H, m), 7.29–7.36 (1H, m), 7.27–7.20 (3H, m), 4.63 (2H, s)

工程 5: 2- { 4- [ 3- (4-クロロフェニル) ピリジン-2-イルメトキ



シ] フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステルの製造

前工程で得られた [3 - (4 - クロロフェニル) ピリジン - 2 - イル] メタノール (200mg) をクロロホルム (3ml) に溶解し、塩化チオニル (0.13ml)、ピリジン (触媒量) を加え、室温で1時間攪拌し、減圧濃縮した。残渣をジメチルホルムアミド (3ml) に溶解し、実施例3と同様にして得られた1 - シクロヘキシル - 2 - (4 - ヒドロキシフェニル) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチルエステル (232mg)、炭酸カリウム (250mg) を加え、80℃で3時間攪拌した。反応液を放冷し、水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 2) で精製し、表題化合物 (246mg, 収率 68%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 8.71 (1H, dd, J=4.7, 1.4Hz), 8.49 (1H, d, J=2.1Hz), 7.96 (1H, d, J=10.2Hz), 7.71-7.62 (2H, m), 7.53 (2H, d, J=8.7Hz), 7.45-7.34 (5H, m), 7.04 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.48-4.29 (3H, m), 2.38-2.19 (2H, m), 2.02-1.22 (11H, m)

#### 実施例 2 4 4

2 - [4 - (2 - ブロモ - 5 - tert - ブトキシカルボニルベンジルオキシ) フェニル] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステルの製造

工程1 : 4 - ブロモ - 3 - メチル安息香酸 - tert - ブチルエステルの製造  
4 - ブロモ - 3 - メチル安息香酸 (25 g) をジクロロメタン (200ml) に懸濁し、塩化オキサリル (12ml)、ジメチルホルムアミド (触媒量) を加え、室温で2時間攪拌した。溶媒を減圧留去して残渣をテトラヒドロフラン (200ml) に溶解し氷冷した。これに、テトラヒドロフラン (150ml) に溶解したカリウム - tert - ブトキシドを滴下し、30 分間攪拌した。反応液に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウム乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (27g, 収率 85%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 7.83 (1H, d, J=2.2Hz), 7.67-7.53 (2H, m), 2.43 (3H, s), 1.58 (9H, s)

工程 2 : 2 - [ 4 - ( 2 - プロモ - 5 - t e r t - ブトキシカルボニルベンジルオキシ ) フェニル ] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた 4 - プロモ - 3 - メチル安息香酸 - t e r t - ブチルエステル ( 7.0g ) 及び実施例 3 と同様にして得られた 1 - シクロヘキシル - 2 - ( 4 - ヒドロキシフェニル ) ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル ( 6.3g ) を用い、実施例 4 と同様の方法により、表題化合物 ( 8.8g, 収率 77% ) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 8.49 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 8.21 (1H, d,  $J=2.1\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, d,  $J=10.2\text{Hz}$ ), 7.82 (1H, d,  $J=10.2\text{Hz}$ ), 7.71-7.58 (4H, m), 7.16 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 5.23 (2H, s), 4.38 (1H, m), 3.95 (3H, s), 2.40-2.23 (2H, m), 2.04-1.90 (4H, m), 1.84-1.73 (1H, m), 1.59 (9H, s), 1.44-1.27 (3H, m)

#### 実施例 2 4 5

2 - { 4 - [ 5 - t e r t - ブトキシカルボニル - 2 - ( 4 - クロロフェニル ) ベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステルの製造

実施例 2 4 4 で得られた 2 - [ 4 - ( 2 - プロモ - 5 - t e r t - ブトキシカルボニルベンジルオキシ ) フェニル ] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル ( 4.5g ) を用い、実施例 5 と同様の方法により、表題化合物 ( 3.6g, 収率 76% ) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 8.48 (1H, s), 8.27 (1H, d,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 8.04 (1H, dd,  $J=7.9, 1.5\text{Hz}$ ), 7.96 (1H, dd,  $J=7.0, 1.5\text{Hz}$ ), 7.65 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.55 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.43-7.32 (5H, m), 7.01 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 4.99 (2H, s), 4.43-4.29 (1H, m), 3.95 (3H, s), 2.41-2.21 (2H, m), 2.02-1.89 (4H, m), 1.82-1.73 (1H, m), 1.62 (9H, s), 1.46-1.28 (3H, m)

#### 実施例 2 4 6

2 - { 4 - [ 5 - カルボキシ - 2 - ( 4 - クロロフェニル ) ベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル 塩酸塩の製造

実施例 2 4 5 で得られた 2 - { 4 - [ 5 - t e r t - ブトキシカルボニル - 2

ー (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (3.5g) をジクロロメタン (35ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (35ml) を加え室温で1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解して、4N 塩酸-酢酸エチルを加え、析出した結晶を濾取、減圧乾燥して表題化合物 (3.3g, 収率 97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ ): 8.33 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 8.24 (1H, d,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 8.09-8.00 (2H, m), 7.74 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.61-7.44 (5H, m), 7.24 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 5.19 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.93 (3H, s), 2.37-1.21 (10H, m)

#### 実施例 2 4 7

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

実施例 2 4 6 で得られた 2- {4- [5-カルボキシー-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル 塩酸塩 (400mg) をジクロロメタン (5ml) に懸濁し、塩化オキサリル (0.08ml)、ジメチルホルムアミド (触媒量) を加え室温で2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をジクロロメタン (5ml) に溶解した。これを、40%メチルアミン水溶液 (5ml)、テトラヒドロフラン (5ml) の混合溶液に、氷冷下滴下した。反応液を1時間攪拌し、減圧濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチル、ジイソプロピルエーテルで結晶化した。これを濾取、減圧乾燥して表題化合物 (335mg, 収率 86%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.47 (1H, s), 8.06 (1H, d,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 7.96 (1H, dd,  $J=8.6, 1.5\text{Hz}$ ), 7.82 (1H, dd,  $J=8.2, 2.2\text{Hz}$ ), 7.64 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.54 (2H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.44-7.31 (5H, m), 6.99 (2H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 6.35-6.26 (1H, m), 5.00 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.95 (3H, s), 3.05 (3H, d,  $J=4.8\text{Hz}$ ), 2.40-1.24 (10H, m)

#### 実施例 2 4 8

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メチルカルバモイルベンジル

オキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸塩酸塩の製造

実施例 2 4 7 で得られた 2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メチルカルバモイルベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル (150mg)、テトラヒドロフラン (2ml) を用い、実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (141mg, 収率 90%) を得た。

APCI-MS: 594 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 8.65-8.58 (1H, m), 8.27 (1H, d, J=1.5Hz), 8.21 (1H, d, J=8.2Hz), 8.15 (1H, d, J=1.5Hz), 8.05-7.90 (2H, m), 7.70 (2H, d, J=8.6Hz), 7.56-7.43 (5H, m), 7.21 (2H, d, J=8.6Hz), 5.14 (2H, s), 4.34 (1H, m), 2.81 (3H, d, J=4.5Hz), 2.39-1.19 (10H, m)

実施例 3 3 6

2 - [ 4 - ( 2 - ブロモ - 5 - ニトロベンジルオキシ ) - 2 - フルオロフェニル ] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステルの製造

市販の 2 - ブロモ - 5 - ニトロトルエンを四塩化炭素 (30ml) に溶解し、N - ブロモコハク酸イミド (2.9g)、N, N' - アゾビスイソブチロニトリル (228mg) を加え、終夜加熱還流した。反応液を放冷し、水を加えクロホルムで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をジメチルホルムアミド (30ml) に溶解し、実施例 3 と同様にして得られた 2 - ( 2 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル (3.8g)、炭酸カリウム (3.8g) を加え 80℃ で 1 時間攪拌した。反応液を放冷し、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) で精製し、表題化合物 (3.7g、収率 61%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.55-8.45 (2H, m), 8.15-8.05 (1H, m), 7.99 (1H, dd, J=8.6Hz, 1.5Hz), 7.70-7.55 (2H, m), 7.05-6.85 (2H, m), 5.24 (2H, s), 4.06 (1H, m), 3.95 (3H, s), 2.35-2.15 (2H, m), 2.05-1.85 (4H, m), 1.80-1.70 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m)

## 実施例 3 3 7

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-ニトロベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

実施例 3 3 6 で得られた 2-[4-(2-ブromo-5-ニトロベンジルオキシ)-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (2.0g)、4-クロロフェニルボロン酸 (590mg)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (396mg) をジメトキシエタン (40ml) に懸濁し、飽和重曹水 (20ml) を加え、1 時間加熱還流した。反応液を放冷して、水を加えクロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2:1) で精製し、表題化合物 (1.9g、収率 90%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.55 (1H, d, J=2.3Hz), 8.49 (1H, d, J=1.4Hz), 8.29 (1H, dd, J=8.4Hz, 2.3Hz), 7.98 (1H, dd, J=8.6Hz, 1.5Hz), 7.60-7.30 (6H, m), 6.85-6.70 (2H, m), 5.03 (2H, s), 4.02 (1H, m), 3.95 (3H, s), 2.35-2.10 (2H, m), 2.05-1.70 (5H, m), 1.40-1.20 (3H, m)

## 実施例 3 3 8

2-[4-{5-アミノ-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

実施例 3 3 7 で得られた 2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-ニトロベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (1.9g) をエタノール (40ml) に懸濁し、塩化第一スズ・二水和物 (3.5g) を加え、30 分加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、4N-水酸化ナトリウムを加え、クロロホルムで抽出した。有機層を 2N-水酸化ナトリウム、水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣にジイソプロピルエーテルを加え、析出した結晶を濾取して、表題化合物 (1.5g、収率 82%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.49 (1H, d, J=1.2Hz), 7.98 (1H, dd, J=9.0, 1.5Hz), 7.66 (1

H, d, J=8.7Hz), 7.49(1H, t, J=8.4Hz), 7.40-7.20(3H, m), 7.13(1H, d, J=8.1Hz), 6.92(1H, d, J=2.7Hz), 6.85-6.65(4H, m), 4.92(2H, s), 4.03(1H, m), 3.95(3H, s), 3.82(2H, brs), 2.30-2.10(2H, m), 2.05-1.80(4H, m), 1.80-1.70(1H, m), 1.40-1.10(3H, m)

### 実施例 3 3 9

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

実施例 3 3 8 で得られた 2-[4-{5-アミノ-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (500mg)、トリエチルアミン (0.14ml) をクロロホルム (5ml) に溶解し、氷冷下、市販のクロロ酪酸クロリド (0.1ml) を加え、室温で 3 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をジメチルホルムアミド (6ml) に溶解し、炭酸カリウム (244mg) を加え 80°C で 1 時間攪拌した。反応液を放冷し、水を加え、析出した結晶を濾取して表題化合物 (502mg, 収率 89%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 4.89(1H, d, J=1.5Hz), 7.98(1H, dd, J=8.6Hz, 1.6Hz), 7.72(1H, d, J=2.2Hz), 7.75-7.65(2H, m), 7.49(1H, t, J=8.3Hz), 7.45-7.20(5H, m), 6.85-7.65(2H, m), 4.99(2H, s), 4.10-3.85(6H, m), 2.66(2H, t, J=7.8Hz), 2.30-2.15(4H, m), 2.00-1.85(4H, m), 1.80-1.70(1H, m), 1.45-1.20(3H, m)

### 実施例 3 4 0

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩の製造

実施例 3 3 9 で得られた 2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (200mg) を用い実施例 2 と同様の方法により、表題化合物 (182mg, 収率 87%) を得た。

Ms: 638 (M+1)

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.28 (1H, d,  $J=1.3\text{Hz}$ ), 8.10 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 8.05–7.90 (2H, m), 7.77 (1H, dd,  $J=8.4\text{Hz}$ ,  $2.2\text{Hz}$ ), 7.61 (1H, t,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.55–7.35 (5H, m), 7.00–7.20 (2H, m), 5.09 (2H, s), 4.06 (1H, m), 3.90 (2H, t,  $J=6.9\text{Hz}$ ), 2.60–2.45 (2H, m), 2.30–2.00 (4H, m), 1.95–1.75 (4H, m), 1.70–1.55 (1H, m), 1.45–1.15 (3H, m)

### 実施例 340 その2

工程 1: 4'-クロロ-4-ニトロ-ビフェニル-2-カルバルデヒドの製造  
2-クロロ-5-ニトロベンズアルデヒド (100g) の 1, 2-ジメトキシエタン (1000ml) 溶液に、4-クロロフェニルボロン酸 (93g)、ビストリフェニルホスフィンパラジウム(II)ジクロリド (380mg)、炭酸水素ナトリウム (68g)、水 (500ml) を加え、1 時間還流した。反応液を 50℃ まで冷却し、酢酸エチル (1000ml) を加え攪拌した。水層を分離して、有機層を水 (500ml)、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 (500ml)、水 (500ml)、28% アンモニア水 (500ml)、水 (500ml)、2 N 塩酸 (500ml)、飽和食塩水 (500ml) で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテル (500ml) に懸濁して濾取、減圧乾燥して、表題化合物 (120g、収率 85%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ): 9.92 (1H, s), 8.61 (1H, d,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 8.53 (1H, dd,  $J=2.6\text{Hz}$ ,  $8.5\text{Hz}$ ), 7.82 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.64 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.59 (2H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ )

工程 2: (4'-クロロ-4-ニトロ-ビフェニル-2-イル) -メタノールの製造

前工程で得られた 4'-クロロ-4-ニトロ-ビフェニル-2-カルバルデヒド (120g) のテトラヒドロフラン (900ml) 溶液を、水素化ホウ素ナトリウム (47g) の 2-プロパノール (600ml) 懸濁液に水冷下、70 分で滴下した。反応液を室温で 1 時間攪拌し、水冷下、2N 塩酸 (185ml) を 40 分で滴下した。室温で 30 分攪拌し、減圧濃縮した。残渣を 2-プロパノール (300ml) に懸濁し、攪拌下水 (1000ml) を加え、30 分攪拌後、結晶を濾取、減圧乾燥して、表題化合物 (116g、収率 96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ ): 8.43 (1H, d,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 8.19 (1H, dd,  $J=2.6\text{Hz}$ ,  $8.4\text{Hz}$ ), 7.57 (2H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.52 (1H, d,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 7.47 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 5.59 (1H, brs), 4.48

(2H, s)

工程 3 : (4-アミノ-4'-クロロ-ビフェニル-2-イル) メタノールの製造

前工程で得られた (4'-クロロ-4-ニトロ-ビフェニル-2-イル) メタノール (1.0g)、ヒドロサルファイトナトリウム (2.0g) の N, N-ジメチルホルムアミド (4ml)、メタノール (1ml) 懸濁液に、100℃にて、水 (0.3ml) を 50  $\mu$ l ずつ 6 回に分けて、20 分ごとに添加した。室温にて水 (5ml) を添加した。室温にて濃塩酸 (2.5ml) を加えた。55℃にて 2.5 時間攪拌後、氷冷下、水酸化ナトリウム (1.2g) を水 (3ml) に溶解した溶液を添加した。水 (5ml) を添加し、室温で 1 時間攪拌後、析出物を濾過、水 (3ml) で洗浄した。この結晶を減圧乾燥して、表題化合物 (700mg、収率 79%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (400MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ ) : 7.39 (2H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.35 (2H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 6.90 (1H, d,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 6.82 (1H, s), 6.56 (1H, d,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 5.20 (2H, brs), 5.04 (1H, t,  $J=5.4\text{Hz}$ ), 4.29 (2H, d,  $J=5.4\text{Hz}$ )

工程 4 : 4-クロロ-N-(4'-クロロ-2-ヒドロキシメチル-ビフェニル-4-イル) プチラミドの製造

前工程で得られた (4-アミノ-4'-クロロ-ビフェニル-2-イル) -メタノール (1.0g) のテトラヒドロフラン (10ml) 溶液に、室温にて酢酸ナトリウム (390mg)、酢酸 (0.27ml) を添加した。

氷冷下、4-クロロブチリルクロライド (0.48ml) をゆっくりと滴下した。室温で 30 分攪拌後、反応液に水 (20ml)、酢酸エチル (20ml) を加え、有機層を分離した。その有機層を飽和重曹水 (20ml)、飽和食塩水 (20ml) で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去し表題化合物 (1.44g、収率 99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 7.68 (1H, s), 7.55 (1H, d,  $J=8.4\text{Hz}$ ), 7.39 (2H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.28 (2H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.22 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 4.58 (2H, s), 3.69 (2H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 2.60 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 2.22 (2H, m)

工程 5 : 1-(4'-クロロ-2-ヒドロキシメチル-ビフェニル-4-イル)-2-ピロリジノンの製造



前工程で得られた 4-クロロ-N-(4'-クロロ-2-ヒドロキシメチル-  
ビフェニル-4-イル)ブチラミド (1.44g) の N,N-ジメチルホルムアミド (15ml)  
溶液に、室温にて炭酸カリウム (710mg) を添加した。100℃にて 90 分攪拌後、室  
温にて、1N塩酸 (5ml)、水 (20ml) を添加し、析出した結晶を濾取、水 (5ml)  
で洗浄した。この結晶を減圧乾燥して、表題化合物 (970mg、収率 76%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 7.76 (1H, d, J=2.3Hz), 7.62 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.3Hz), 7.38  
(2H, d, J=8.5Hz), 7.29 (2H, d, J=8.5Hz), 7.25 (1H, d, J=8.3Hz), 4.61 (2H, s), 3.91 (2H,  
t, J=7.0Hz), 2.62 (2H, t, J=7.8Hz), 2.18 (2H, m)

工程 6 : 1-(4'-クロロ-2-クロロメチル-ビフェニル-4-イル)-  
2-ピロリジノンの製造

前工程で得られた 1-(4'-クロロ-2-ヒドロキシメチル-ビフェニル-  
4-イル)-2-ピロリジノン (900mg) の N,N-ジメチルホルムアミド (2ml)、  
トルエン (7ml) 混合溶液に、氷冷下、塩化チオニル (0.26ml) を滴下した。室温  
で 3 時間攪拌後、反応液を酢酸エチル (20ml) で薄め、水 (20ml)、飽和重曹水 (20ml)、  
飽和食塩水 (20ml) で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶媒  
を減圧留去し表題化合物 (954mg、収率 99%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 7.77 (1H, d, J=2.3Hz), 7.69 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.5Hz), 7.42  
(2H, d, J=8.6Hz), 7.34 (2H, d, J=8.6Hz), 7.26 (1H, d, J=8.4Hz), 4.50 (2H, s), 3.92 (2H,  
t, J=7.0Hz), 2.65 (2H, t, J=7.8Hz), 2.20 (2H, m)

工程 7 : 2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキシピロリ  
ジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシ  
ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

実施例 18 で得られた 1-シクロヘキシル-2-(2-フルオロ-4-ヒドロキ  
シフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル (915mg) の N,  
N-ジメチルホルムアミド (6ml) 懸濁液に、室温にて前工程で得られた 1-(4'  
-クロロ-2-クロロメチル-ビフェニル-4-イル)-2-ピロリジノン  
(954mg)、炭酸カリウム (415mg) を加えた。100℃で 1 時間攪拌後、室温にて、1  
N塩酸 (3ml)、水 (8ml) を添加し、析出した結晶を濾取、水 (5ml) で洗浄した。  
この結晶を減圧乾燥して、表題化合物 (1.6g、収率 100%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 8.49 (1H, d, J=1.5Hz), 7.98 (1H, dd, J=1.6Hz, 8.6Hz), 7.90 (1H, d, J=2.2Hz), 7.72-7.65 (2H, m), 7.49 (1H, t, J=8.3Hz), 7.40 (2H, d, J=8.5Hz), 7.34 (1H, d, J=8.7Hz), 7.31 (2H, d, J=8.6Hz), 6.80 (1H, d, J=8.6Hz), 6.71 (1H, d, J=11.6Hz), 4.99 (2H, s), 4.04 (1H, m), 3.95 (3H, s), 3.93 (2H, t, J=7.1Hz), 2.66 (2H, t, J=7.8Hz), 2.30-2.15 (4H, m), 2.00-1.85 (4H, m), 1.80-1.70 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m)

工程 8 : 2 - [ 4 - { 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ) ベンジルオキシ } - 2 - フルオロフェニル ] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸の製造

前工程で得られた 2 - [ 4 - { 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ) ベンジルオキシ } - 2 - フルオロフェニル ] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル (2.0g) をメタノール (4.0ml)、テトラヒドロフラン (8.0ml) に懸濁させ、2N 水酸化ナトリウム水溶液 (2.3ml) を加え 3 時間加熱還流した。反応液を放冷し、テトラヒドロフラン (1.0ml)、水 (5.0ml) を添加した。室温にて、2N 塩酸 (2.3ml) をゆっくりと加えた。室温で 2 時間攪拌後、析出した結晶を濾取し、メタノール - 水 (1:1) 混合溶液 (6.0ml)、水 (6.0ml)、メタノール - 水 (1:1) 混合溶液 (6.0ml) で順次洗浄し、減圧乾燥し、表題化合物 (1.84g、収率 94%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : 12.75 (1H, brs), 8.26 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=9.0Hz), 7.89 (1H, d, J=9.0Hz), 7.78 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.4Hz), 7.54 (1H, t, J=9.0Hz), 7.49 (2H, d, J=8.7Hz), 7.45 (2H, d, J=8.4Hz), 7.38 (1H, d, J=8.4Hz), 7.08 (1H, dd, J=2.1Hz, 12.0Hz), 6.96 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.7Hz), 5.09 (2H, s), 3.99 (1H, m), 3.91 (2H, t, J=6.6Hz), 2.54 (2H, t, J=7.8Hz), 2.30-2.00 (4H, m), 1.95-1.50 (5H, m), 1.45-1.20 (3H, m)

工程 9 : 2 - [ 4 - { 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ) ベンジルオキシ } - 2 - フルオロフェニル ] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 塩酸塩の製造

4 N 塩酸 (50ml) に前工程で得られた 2 - [ 4 - { 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ) ベンジルオキシ } - 2 - フルオロフェニル ] - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (10.0g)、アセ

トノーメチルエチルケトン (3:2) 混合溶液 (20ml) を順次添加し、60℃で3時間、室温で1時間攪拌した。結晶を濾取し、アセトン (10ml) で2回洗浄した後、減圧乾燥し、表題化合物 (9.62g、収率91%) を得た。

融点：243-246℃

Ms：638 (M+1)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : 8.33 (1H, d, J=1.1Hz), 8.21 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, d, J=8.8Hz), 8.00 (1H, d, J=2.2Hz), 7.77 (1H, dd, J=2.2Hz, 8.4Hz), 7.68 (1H, t, J=8.4Hz), 7.50 (2H, d, J=8.4Hz), 7.45 (2H, d, J=8.4Hz), 7.39 (1H, d, J=8.4Hz), 7.20 (1H, dd, J=2.2Hz, 12.1Hz), 7.06 (1H, dd, J=2.2Hz, 8.8Hz), 5.11 (2H, s), 4.13 (1H, m), 3.91 (2H, t, J=7.0Hz), 2.54 (2H, t, J=8.1Hz), 2.40-2.05 (4H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)

実施例1から30、実施例241から248及び実施例336から340と同様な方法により、また必要に応じその他常法を用いることにより、実施例31から240、実施例249から335、341から471、701から703、1001から1559を得た。化学構造式及び物性値を表1乃至177、185乃至212、219乃至221、225乃至269に示す。

#### 実施例501

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

工程1：3-ブロモ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステルの製造

3-ブロモ-4-フルオロ安息香酸 (2.0g) をメタノール (20ml) に溶解し、濃硫酸 (2ml) を加え、3時間還流した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチル (50ml) で抽出した。有機層を水 (30ml)、飽和食塩水 (30ml) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去した。残渣をジメチルスルホキシド (20ml) に溶解し、シクロヘキシルアミン (10.3ml) を加え、120℃で終夜攪拌した。反応液を10%クエン酸水溶液 (100ml) に注ぎ、酢酸エチル (100ml) で抽出した。有機層を水 (50ml)、飽和食塩水 (50ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶

媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー（展開溶媒 n-ヘキサン：酢酸エチル＝10：1）で精製し、表題化合物（2.6g, 収率 92%）を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.10 (1H, d, J=1.9Hz), 7.83 (1H, dd, J=1.9Hz, 8.6Hz), 6.59 (1H, d, J=8.7Hz), 4.73 (1H, brd, J=7.3Hz), 3.85 (3H, s), 3.38 (1H, m), 2.10-2.00 (2H, m), 1.90-1.20 (8H, m)

工程 2 : 4'-クロロ-2-(4-ヨードフェノキシメチル)-4-メトキシビフェニルの製造

4-ヨードフェノール(5.0g)をアセトン(50ml)に溶解し、炭酸カリウム(4.7g)、4'-クロロ-2-クロロメチル-4-メトキシビフェニル(6.0g)を加え、10時間還流した。反応液を濃縮し、4N水酸化ナトリウム水溶液(50ml)を加えた。析出した結晶を濾取、水洗、減圧乾燥し、表題化合物(10.0g, 収率 98%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 7.52 (2H, d, J=8.9Hz), 7.35 (2H, d, J=8.5Hz), 7.27-7.20 (3H, m), 7.12 (1H, s), 6.95 (1H, d, J=8.5Hz), 6.62 (2H, d, J=8.9Hz), 4.84 (2H, s), 3.85 (3H, s)

工程 3 : [4-(4'-クロロ-4-メトキシビフェニル-2-イルメトキシ)フェニルエチニル]トリメチルシランの製造

前工程で得られた4'-クロロ-2-(4-ヨードフェノキシメチル)-4-メトキシビフェニル(7.0g)をアセトニトリル(50ml)に溶解し、トリメチルシリルアセチレン(2.3g)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム錯体(1.8g)、ヨウ化銅(I)(0.6g)、トリエチルアミン(50ml)を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を濃縮し、水(30ml)を加え、酢酸エチル(50ml)で抽出した。有機層を水(30ml)、飽和食塩水(30ml)で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー（展開溶媒 n-ヘキサン：酢酸エチル＝10：1）で精製し、表題化合物(5.1g, 収率 79%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 7.37 (2H, d, J=8.9Hz), 7.34 (2H, d, J=8.2Hz), 7.28-7.21 (3H, m), 7.13 (1H, s), 6.94 (1H, d, J=8.2Hz), 6.75 (2H, d, J=8.9Hz), 4.87 (2H, s), 3.85 (3H, s), 0.23 (9H, s)

工程 4 : 3-[4-(4'-クロロ-4-メトキシビフェニル-2-イルメトキシ)フェニルエチニル]-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステル

## の製造

前工程で得られた [4-(4'-クロロ-4-メトキシビフェニル-2-イルメトキシ)フェニルエチニル]トリメチルシラン (5.1g) をメタノール (50ml)、クロロホルム (50ml) に溶解し、炭酸カリウム (2.5g) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を濃縮し、水 (30ml) を加え、酢酸エチル (50ml) で抽出した。有機層を水 (30ml)、飽和食塩水 (30ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去し白色結晶 (3.8g) を得た。この白色結晶 (2.3g) をアセトニトリル (10ml) に溶解し、工程1で得られた3-ブロモ-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステル (1.0g)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム錯体 (0.4g)、ヨウ化銅 (I) (0.1g)、トリエチルアミン (10ml) を加え、100°C で終夜攪拌した。反応液を減圧濃縮し、水 (30ml) を加え、酢酸エチル (50ml) で抽出した。有機層を水 (30ml)、飽和食塩水 (30ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン:酢酸エチル=8:1) で精製し、表題化合物 (0.9g, 収率 49%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 8.03 (1H, s), 7.84 (1H, d,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.42-7.22 (7H, m), 7.15 (1H, s), 6.95 (1H, d,  $J=8.2\text{Hz}$ ), 6.85 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.59 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 5.07 (1H, brs), 4.91 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.42 (1H, m), 2.15-2.00 (2H, m), 1.80-1.20 (8H, m)

工程5: 2-[4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル]-1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸メチルエステルの製造

前工程で得られた3-[4-(4'-クロロ-4-メトキシビフェニル-2-イルメトキシ)フェニルエチニル]-4-シクロヘキシルアミノ安息香酸メチルエステル (0.5g) をN,N-ジメチルホルムアミド (5ml) に溶解し、ヨウ化銅 (I) (0.17g) を加え、180°C で3時間還流した。反応液を濾過することにより不溶物を除いた後、水 (10ml) を加え、酢酸エチル (30ml) で抽出した。有機層を水 (10ml)、飽和食塩水 (10ml) で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、溶媒を減圧留去、シリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン:酢酸エチル=

8 : 1) で精製し、表題化合物 (0.27g, 収率 55%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 8.34 (1H, s), 7.85 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.40-7.18 (8H, m), 7.00-6.94 (3H, m), 6.48 (1H, s), 4.95 (2H, m), 4.18 (1H, m), 3.93 (3H, s), 3.88 (3H, s), 2.45-2.25 (2H, m), 1.95-1.20 (8H, m)

#### 実施例 5 0 2

2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メトキシベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸の製造

実施例 5 0 1 で得られた 2 - { 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メトキシベンジルオキシ ] フェニル } - 1 - シクロヘキシル - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸メチルエステル (0.27g) を用い、実施例 2 と同様な方法により、表題化合物 (0.19g, 収率 71%) を得た。

APCI- $\text{Ms}$ : 566 ( $\text{MH}^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ ) : 12.43 (1H, brs), 8.20 (1H, s), 7.79 (1H, d,  $J=9.3\text{Hz}$ ), 7.72 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.50-7.20 (8H, m), 7.07-7.03 (3H, m), 6.53 (1H, s), 5.01 (2H, s), 4.13 (1H, m), 3.83 (3H, m), 2.35-2.25 (2H, m), 1.85-1.10 (8H, m)

実施例 5 0 1 及び 5 0 2 と同様な方法により、また必要に応じてその他常法を用いることにより、実施例 5 0 3 を得た。化学構造式及び物性値を表 2 0 7 に示す。

#### 実施例 6 0 1

2 - ( 4 - ベンジルオキシフェニル ) - 3 - シクロヘキシルイミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジン - 7 - カルボン酸エチルエステルの製造

工程 1 : 4 - ベンジルオキシ - N - メトキシ - N - メチルベンズアミドの製造

4 - ベンジルオキシ安息香酸 (5.0g)、N, O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (2.5g) をジメチルホルムアミド (50ml) に懸濁し、1 - ( 3 - ジメチルアミノプロピル ) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (5.0g)、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (3.5g)、トリエチルアミン (3.6ml) を加え、室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和重曹水、水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、表題化合物 (5.6g, 収率 94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 7.22 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.28-7.46 (5H, m), 6.97 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 5.10 (2H, s), 3.56 (3H, s), 3.35 (3H, s)

工程 2 : 1 - (4-ベンジルオキシフェニル) - 2 - シクロヘキシルエタノールの製造

マグネシウム (470mg) をテトラヒドロフラン (2ml) に懸濁し、シクロヘキシルメチルブロミド (3.4g) を室温で滴下した。滴下後、反応液を  $60^\circ\text{C}$  で 30 分攪拌した。反応液を放冷し、テトラヒドロフラン (5ml) で希釈した。前工程で得られた 4-ベンジルオキシ-N-メトキシ-N-メチルベンズアミド (3.4g) をテトラヒドロフラン (10ml) に溶解し、室温で反応液に滴下し、2 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 9 : 1) で精製し、表題化合物 (3.8g, 収率 66%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 7.93 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.28-7.46 (5H, m), 7.00 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 5.13 (2H, s), 2.76 (2H, d,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 1.95 (1H, m), 0.78-1.82 (10H, m)

工程 3 : 1 - (4-ベンジルオキシフェニル) - 2 - ブロモ - 2 - シクロヘキシルエタノールの製造

前工程で得られた 1 - (4-ベンジルオキシフェニル) - 2 - シクロヘキシルエタノン (1.0g) を 1, 4-ジオキサン (10ml) に溶解して、臭素 (0.17ml) を加え室温で 10 分間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 9 : 1) で精製し、表題化合物 (696mg, 収率 55%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) : 7.98 (2H, d,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 7.28-7.48 (5H, m), 7.02 (2H, d,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 5.14 (2H, s), 4.89 (1H, d,  $J=9.3\text{Hz}$ ), 0.86-3.30 (11H, m)

工程 4 : 2 - (4-ベンジルオキシフェニル) - 3 - シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸エチルエステルの製造

公知の方法 (特開平 08-048651 号) により製造した 2-アミノピリジン-4-

カルボン酸エチルエステル (214mg)、前工程で得られた 1 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 2 - ブロモ - 2 - シクロヘキシルエタノン (500mg)、炭酸カリウム (356mg) を 140℃ で 5 時間攪拌した。反応液を放冷し、クロロホルムを加え不溶物を濾別し減圧濃縮した。残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー (展開溶媒 n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) で精製し、表題化合物 (95mg, 収率 16%) を得た。

APCI-MS: 455 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): 8.33 (1H, s), 8.21 (1H, d, J=7.5Hz), 7.55 (2H, d, J=8.7Hz), 7.25-7.50 (6H, m), 5.13 (2H, s), 4.41 (2H, q, J=7.1Hz), 3.25 (1H, m), 1.41 (3H, t, J=7.1Hz), 1.15-2.00 (10H, m)

#### 実施例 602

2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 3 - シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸の製造

前工程で得られた 2 - (4 - ベンジルオキシフェニル) - 3 - シクロヘキシルイミダゾ [1, 2-a] ピリジン-7-カルボン酸エチルエステル (95mg) を用い、実施例 2 と同様な方法により、表題化合物 (33mg, 37%) を得た。

APCI-MS: 427 (MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>): 8.67 (1H, d, J=7.3Hz), 8.08 (1H, s), 7.25-7.58 (8H, m), 7.13 (2H, d, J=8.7Hz), 5.17 (2H, s), 3.23 (1H, m), 1.25-2.10 (10H, m)

実施例 1 から 703 と同様な方法により、また必要に応じその他常法を用いることにより、更に表 213 乃至 218 に示される化合物を得ることが出来る。

次に、本発明化合物の HCV ポリメラーゼ阻害活性の評価方法について説明する。当該ポリメラーゼは、HCV の RNA 遺伝子上の NS5B と呼ばれる非構造タンパク領域にコードされる酵素である (EMBO J., 15:12-22, 1996)。

#### 試験例 [I]

##### i) 酵素 (HCV ポリメラーゼ) の調製法

C 型肝炎の患者血液より採取した HCV BK 株の全長 RNA 遺伝子に対応する cDNA クローンを鋳型として、NS5B (591 アミノ酸; J Virol 1991 Mar, 65(3), 1105-13) をコードする領域を PCR 法により増幅した。この 5' 末端に 6



H i s タグ {連続する 6 つのヒスチジン (H i s) をコードする塩基対} を付加して得た目的遺伝子を、大腸菌に形質転換した。目的蛋白質産生大腸菌を培養した後、菌体を、界面活性剤を含む緩衝液中で懸濁し、マイクロフルイダイザーにて破碎した。次に遠心した上清を、金属キレートクロマトグラフィーを含む各種カラムクロマトグラフィー {ポリ[U]-セファロース、セファクリル S-200、モノ-S (ファルマシア社製)} で処理することにより酵素標品を得た。

ii) 基質 RNA の合成

H C V ゲノムの 3' 非翻訳領域配列をもとに設計した合成プライマーを用いて、p o l y U 及び 3' X 配列を含む DNA 断片 (148bp) を全合成し、プラスミド pBluescript SK II (+) (Stratagene 社製) にクローニングした。前記 i) で調製した NS 5 B 全長をコードする c DNA を制限酵素 K p n I で消化し、該制限酵素切断部位から終止コドンまでの塩基配列からなる c DNA 断片を得た。この c DNA 断片を pBluescript SK II (+) の 3' 非翻訳領域 DNA の上流に挿入、接続した。この様にして挿入されたあわせて約 450bp の DNA 配列を基質 RNA 調製の鋳型とした。該プラスミドを 3' X 配列の直後で切断し、線状化した後、フェノール・クロロホルム処理、エタノール沈殿法により精製し、DNA を回収した。

該精製した DNA を鋳型として、pBluescript SK II (+) のプロモーターを利用し、MEGA s c r i p t RNA 合成キット (A m b i o n 社製) 及び T 7 RNA ポリメラーゼを用いて r u n - o f f 法により、RNA 合成を行った (37℃、3 時間)。ついで、D N a s e I を加えてさらに 1 時間インキュベートした後、鋳型 DNA を分解除去することにより RNA 粗生成物を得た。該粗生成物をフェノール・クロロホルム処理、エタノール沈殿法によって精製することにより目的の基質 RNA を得た。

該 RNA は、ホルムアルデヒド変性アガロースゲル電気泳動で品質を確認した後、-80℃で保存した。

iii) 酵素 (H C V ポリメラーゼ) 阻害活性の測定

被験物質 (本発明の化合物) 及び下記組成の反応液 (30 μ l) を、25℃で 90 分間反応させた。

次いで、該反応液に 4℃の 10% トリクロロ酢酸及び 1% ピロリン酸ナトリウ

ム溶液 ( $150 \mu\text{l}$ ) を加えて反応を停止させた後、氷中で15分間放置してRNAを不溶化させた。次いで該RNAを吸引濾過によりガラスフィルター (Whatman社製GF/C等) にトラップした。該フィルターを1%トリクロロ酢酸及び0.1%ピロリン酸ナトリウムからなる溶液で洗浄し、次いで90%エタノールで洗浄後、乾燥させた。液体シンチレーションカクテル (Packard社) を加え、酵素反応により合成されたRNAの放射活性を液体シンチレーションカウンターで測定した。

本発明化合物のHCVポリメラーゼ阻害活性 ( $\text{IC}_{50}$ ) は、被験物質を加えた場合の酵素反応における放射活性の値と被験物質を加えない場合の酵素反応における放射活性の値から算出した。

結果を表178から表184、表222から224に示す。

反応液: i) で得られたHCVポリメラーゼ ( $5 \mu\text{g}/\text{ml}$ )、ii) で得られた基質RNA ( $10 \mu\text{g}/\text{ml}$ )、ATP ( $50 \mu\text{M}$ )、GTP ( $50 \mu\text{M}$ )、CTP ( $50 \mu\text{M}$ )、UTP ( $2 \mu\text{M}$ )、 $[5, 6-^3\text{H}] \text{UTP}$  ( $46 \text{Ci}/\text{mmol}$  (Amersham社製),  $1.5 \mu\text{Ci}$ )  $20 \text{mM}$  Tris-HCl (pH 7.5)、EDTA ( $1 \text{mM}$ )、 $\text{MgCl}_2$  ( $5 \text{mM}$ )、NaCl ( $50 \text{mM}$ )、DTT ( $1 \text{mM}$ )、BSA ( $0.01\%$ )

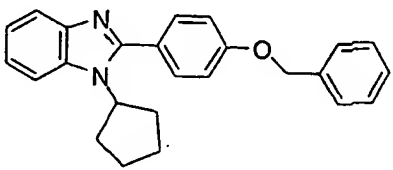
以下に製剤例を挙げるが、これに限定されるものではない。

#### 製剤例

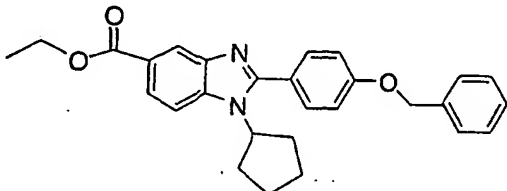
(a) 実施例1の化合物	10 g
(b) 乳糖	50 g
(c) トウモロコシデンプン	15 g
(d) カルボキシメチルセルロースナトリウム	44 g
(e) ステアリン酸マグネシウム	1 g

(a)、(b)、(c) の全量及び (d) の30 gを水で練合し、真空乾燥後、製粒を行う。この製粒末に14 gの (d) 及び1 gの (e) を混合し、打錠機で錠剤とすることにより、1錠あたり10 mgの (a) を含有する錠剤1000個を製造する。

表 1

実施例番号	31	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl <sub>3</sub> 7.81 (2H, d, J=6.6Hz), 7.60 (2H, d, J=8.8Hz), 7.51-7.21 (8H, m), 7.11 (2H, d, J=8.8Hz), 5.15 (2H, s), 4.93 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.36-2.32 (2H, m), 2.09-2.04 (3H, m), 1.75-1.68 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	369 (M+1)	

実施例番号	32	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl <sub>3</sub> 8.51 (1H, d, J=1.5Hz), 7.98 (1H, d, J=8.4Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.56-7.10 (6H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=9.3Hz), 4.41 (2H, q, J=7.5Hz), 2.40-1.50 (8H, m), 1.41 (3H, t, J=7.5Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	441 (M+1)	

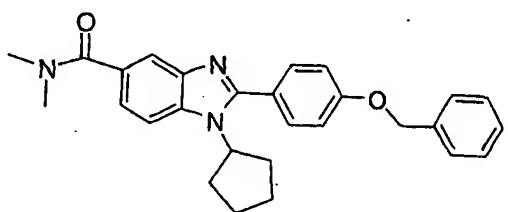
実施例番号	33	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl <sub>3</sub> 7.84 (1H, s), 7.61 (2H, d, J=9.0Hz), 7.58-7.30 (7H, m), 7.12 (2H, d, J=9.0Hz), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.10 (6H, brs), 2.40-1.50 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	440 (M+1)	

表 2

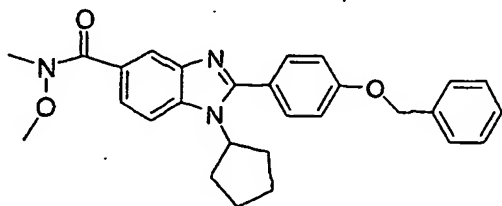
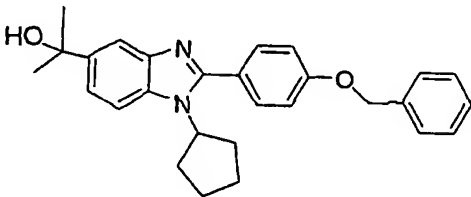
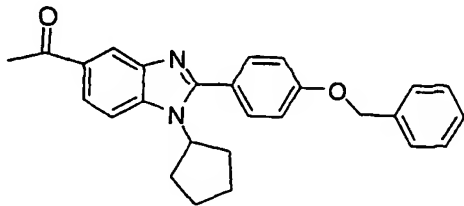
実施例番号	34	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDC13 8.20 (1H, s), 7.50-7.31 (9H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.61 (3H, s), 3.40 (3H, s), 2.41-1.42 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	456 (M+1)	
実施例番号	35	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDC13 7.91 (1H, s), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.49-7.30 (7H, m), 7.11 (2H, d, J=8.8Hz), 5.15 (2H, s), 4.19 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.41-2.22 (2H, m), 2.13-1.49 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	427 (M+1)	
実施例番号	36	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDC13 8.40 (1H, d, J=1.4Hz), 7.95 (1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.57-7.30 (6H, m), 7.13 (2H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.64 (3H, s), 2.40-1.54 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	411 (M+1)	

表 3

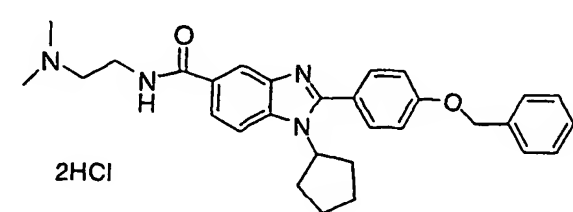
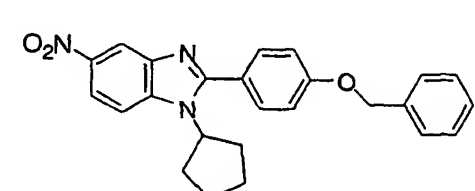
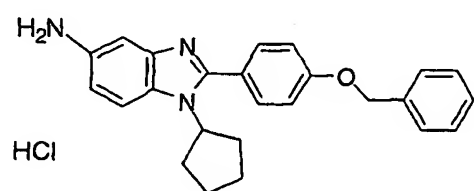
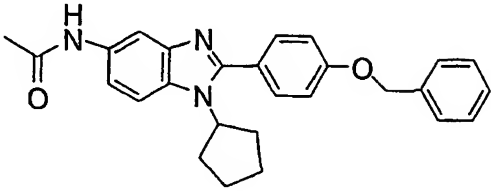
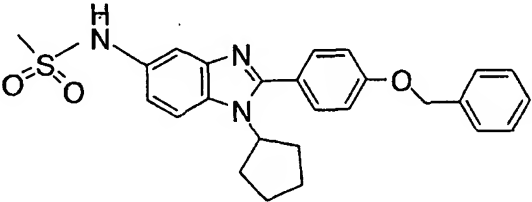
実施例番号	37	1H NMR (δ) ppm
 <p>2HCl</p>		300MHz, DMSO-d6 10.47 (1H, brs, ), 9.15 (1H, brs), 8.40 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=9.0Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=8.7Hz), 7.55-7.29 (7H, m), 5.26 (2H, s), 4.93 (1H, quint, J=9.0Hz), 3.77-3.63 (2H, m), 3.39-3.23 (2H, m), 2.84 (6H, d, J=4.8Hz), 2.32-1.60 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	483 (M+1)	
実施例番号	38	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl3 8.69 (1H, s), 8.19 (1H, d, J=9.0Hz), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz), 7.54 (1H, d, J=9.0Hz), 7.48-7.36 (5H, m), 7.15 (2H, d, J=8.7Hz), 5.17 (2H, s), 4.98 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.27-2.07 (6H, m), 1.82-1.78 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	414 (M+1)	
実施例番号	39	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		300MHz, DMSO-d6 7.84 (1H, d, J=9.0Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.52-7.33 (8H, m), 7.26 (1H, d, J=9.0Hz), 5.27 (2H, s), 4.92 (1H, quint, J=9.3Hz), 2.19-1.70 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	384 (M+1)	

表 4

実施例番号	40	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl <sub>3</sub> 7.72 (1H, s), 7.60-7.35 (10H, m), 7.10 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.90 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.29-2.19 (2H, m), 2.19 (3H, s), 2.19-1.74 (6H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	426 (M+1)	

実施例番号	41	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl <sub>3</sub> 7.66 (1H, s), 7.61 (2H, d, J=8.8Hz), 7.50-7.28 (7H, m), 7.12 (2H, d, J=8.8Hz), 6.86 (1H, brs), 5.15 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.97 (3H, s), 2.29-1.76 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	462 (M+1)	

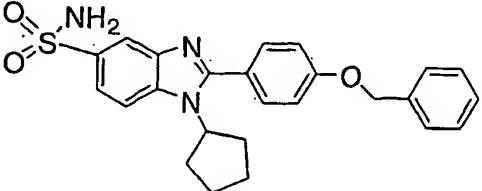
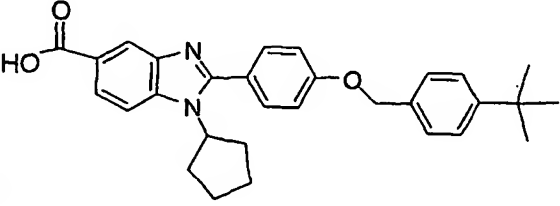
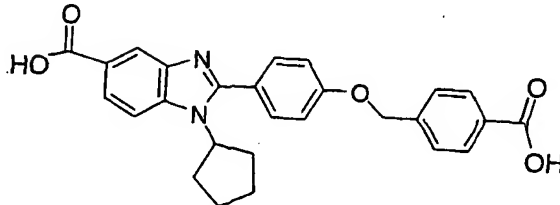
実施例番号	42	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.11 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=8.4Hz), 7.72 (1H, d, J=8.4Hz), 7.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.51 (2H, m), 7.43 (2H, m), 7.37 (1H, m), 7.29 (2H, s), 7.23 (2H, d, J=8.4Hz), 5.22 (2H, s), 4.89 (1H, quintet, J=9.2Hz), 2.2-2.0 (6H, m), 1.7 (2H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	448 (M+)	

表 5

実施例番号	43	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=9.0Hz), 7.99 (1H, d, J=9.0Hz), 7.47-7.41 (4H, m), 7.33 (2H, d, J=8.4Hz), 5.22 (2H, s), 4.96 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.25-1.60 (8H, m), 1.30 (9H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	469 (M+1)	

実施例番号	44	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.9 (2H, brs), 8.25 (1H, s), 8.00 (2H, d, J=7.8Hz), 7.90 (1H, d, J=8.4Hz), 7.74 (1H, d, J=8.7Hz), 7.67 (2H, d, J=9.0Hz), 7.62 (2H, d, J=8.1Hz), 7.24 (2H, d, J=8.4Hz), 5.32 (2H, s), 4.88 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.25-1.60 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	457 (M+1)	

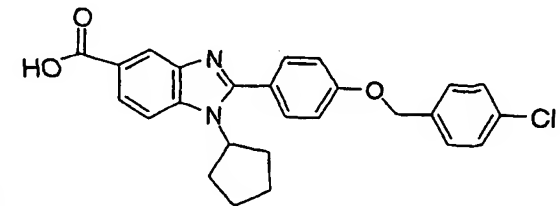
実施例番号	45	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.4 (1H, brs), 8.32 (1H, s), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.79 (2H, d, J=8.8Hz), 7.56-7.48 (4H, m), 7.33 (2H, d, J=8.8Hz), 5.27 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=8.9Hz), 2.30-1.60 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	447 (M+1)	

表 6

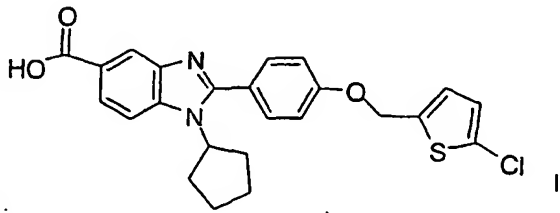
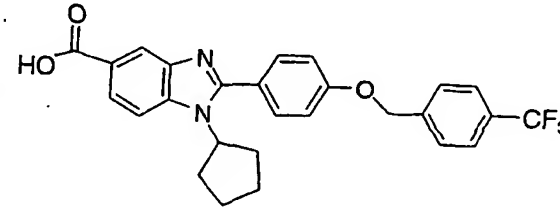
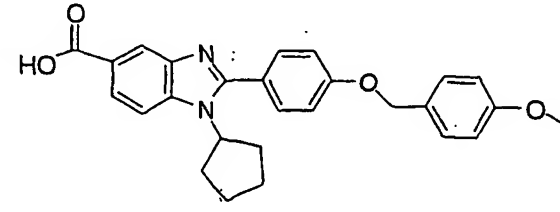
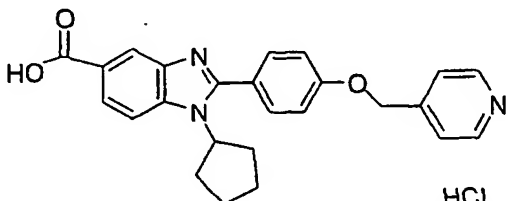
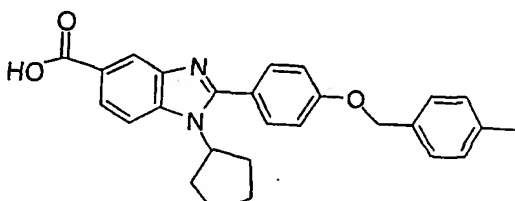
実施例番号	46	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.7Hz), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.4Hz), 7.34 (2H, d, J=8.4Hz), 7.19 (1H, d, J=3.6Hz), 7.09 (1H, d, J=3.6Hz), 5.41 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.30-1.60 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	453 (M+1)	
実施例番号	47	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.4Hz), 7.98 (1H, d, J=9.0Hz), 7.82-7.72 (6H, m), 7.35 (2H, d, J=9.0Hz), 5.40 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.35-1.60 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	481 (M+1)	
実施例番号	48	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.70 (1H, d, J=8.4Hz), 7.64 (2H, d, J=8.4Hz), 7.43 (2H, d, J=8.4Hz), 7.20 (2H, d, J=8.4Hz), 6.98 (2H, d, J=8.4Hz), 5.13 (2H, s), 4.88 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.77 (3H, s), 2.35-1.60 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	443 (M+1)	



表 7

実施例番号	49	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.93 (2H, d, J=6.6Hz), 8.35 (1H, s), 8.06-8.04 (3H, m), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.83 (2H, d, J=8.7Hz), 7.38 (2H, d, J=8.7Hz), 5.61 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.40-1.60 (8H, m).
 HCl		
純度	> 90% (NMR)	
MS	414 (M+1)	

実施例番号	50	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.7Hz), 7.99 (1H, d, J=9.0Hz), 7.78 (2H, d, J=8.4Hz), 7.39 (2H, d, J=8.1Hz), 7.32 (2H, d, J=8.7Hz), 7.23 (2H, d, J=7.8Hz), 5.22 (2H, s), 4.96 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.32 (3H, s), 2.30-1.60 (8H, m).
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	427 (M+1)	

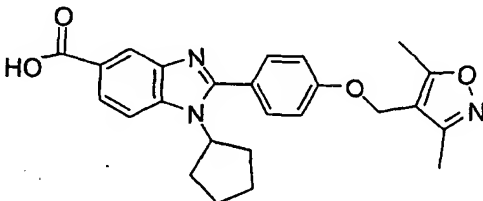
実施例番号	51	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.03 (1H, d, J=9.0Hz), 7.93 (1H, d, J=9.0Hz), 7.77 (2H, d, J=8.4Hz), 7.31 (2H, d, J=8.7Hz), 5.07 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.45 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.26-1.60 (8H, m).
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	432 (M+1)	

表 8

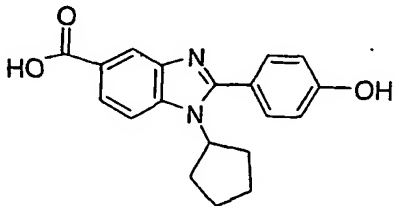
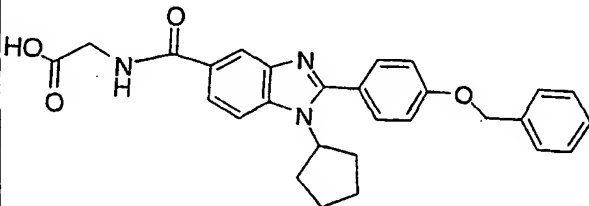
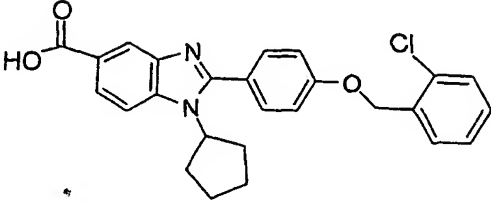
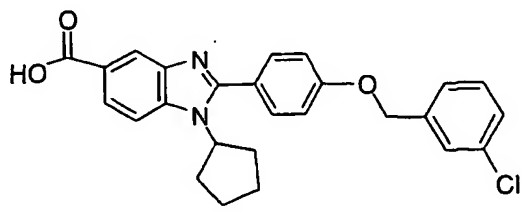
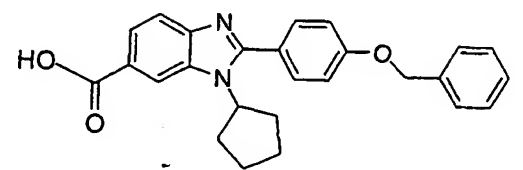
実施例番号	52	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.7 (1H, brs), 10.0 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.69 (1H, d, J=8.6Hz), 7.53 (2H, d, J=8.6Hz), 6.96 (2H, d, J=8.6Hz), 4.89 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.30-1.60 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	323 (M+1)	
実施例番号	53	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.18 (1H, t, J=5.6Hz), 8.34 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=9.6Hz), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.7Hz), 7.52-7.32 (7H, m), 5.27 (2H, s), 4.95 (1H, quint, J=9.0Hz), 3.99 (2H, d, J=5.7Hz), 2.40-1.60 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	470 (M+1)	
実施例番号	54	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.4Hz), 7.67 (1H, t, J=4.5Hz), 7.56 (1H, t, J=4.5Hz), 7.45-7.42 (2H, m), 7.35 (2H, d, J=8.4Hz), 5.31 (2H, s), 4.96 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.30-1.60 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	447 (M+1)	

表 9

実施例番号	55	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.78 (1H, br s), 8.24 (1H, s), 7.88 and 7.72 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.66 and 7.23 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.58 (1H, s), 7.48-7.42 (3H, m), 5.24 (1H, s), 4.88 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.30-1.91 (6H, m), 1.78-1.60 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	447 (M+1)	

実施例番号	56	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.89 (1H, broad), 8.18 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=8.4Hz), 7.74 (1H, d, J=9.2Hz), 7.67 (2H, d, J=8.8Hz), 7.52 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.38 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.8Hz), 5.22 (2H, s), 4.94 (1H, quintet, J=8.9Hz), 2.16 (4H, m), 1.98 (2H, m), 1.73 (2H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	413 (M+)	

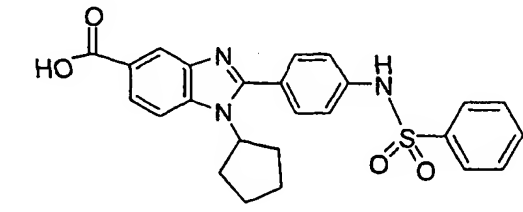
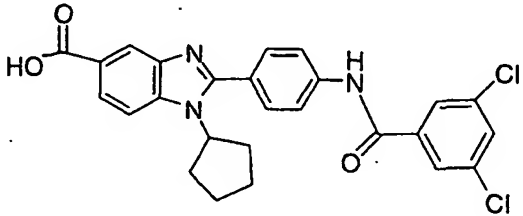
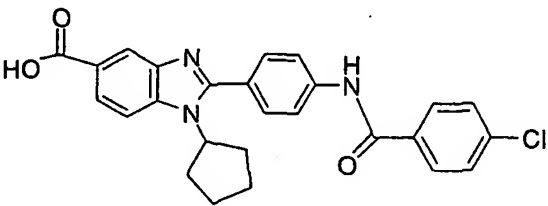
実施例番号	57	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.99 (1H, s), 8.26 (1H, s), 8.01-7.86 (4H, m), 7.69-7.59 (5H, m), 7.38 (2H, d, J=8.7Hz), 4.86 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.12-1.90 (6H, m), 1.72-1.59 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	462 (M+1)	

表 10

実施例番号	58	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.78 (1H, s), 10.69 (1H, s), 8.26-7.72 (9H, m), 4.92 (1H, quint, J=9.0Hz), 2.34-1.70 (6H, m), 1.75-1.61 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	494 (M+1)	

実施例番号	59	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.82 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8 .14 and 7.84 (4H, ABq, J=8.4H z), 8.06 and 7.66 (4H, A'B' q, J=8.6Hz), 8.06-7.98 (4H, m) , 5.01 (1H, quint, J=9.3Hz), 2.35-2.15 (4H, m), 2.11-1.9 6 (2H, m), 1.80-1.62 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	460 (M+1)	

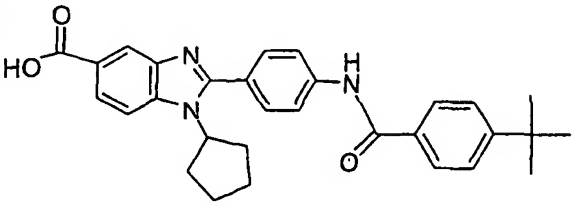
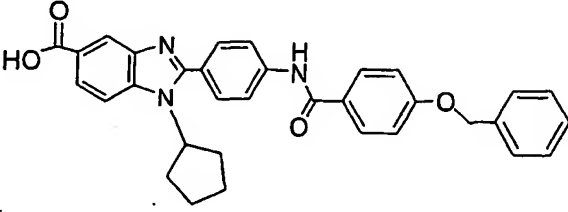
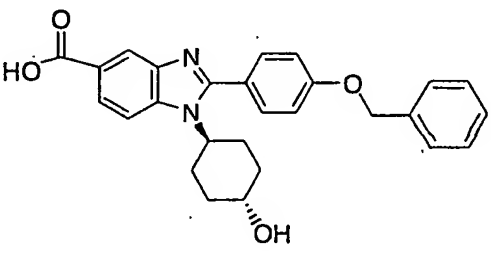
実施例番号	60	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.61 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8 .12 and 7.81 (4H, ABq, J=8.9H z), 8.03 and 7.93 (2H, A'B' q, J=8.7Hz), 7.95 and 7.59 (4H, A''B'' q, J=8.4Hz), 4.99 (1H, q uint, J=9.0Hz), 2.33-2.12 (4 H, m), 2.10-1.93 (2H, m), 1. 80-1.63 (2H, m), 1.34 (9H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	482 (M+1)	

表 11

実施例番号	61	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.6 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.13 (2H, d, J=8.7Hz), 8.09-7.98 (4H, m), 7.82 (2H, d, J=8.7Hz), 7.50-7.35 (5H, m), 7.20-7.17 (2H, d, J=9.0Hz), 5.24 (2H, s), 5.01 (1H, quint, J=9.3Hz), 2.40-1.60 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	532 (M+1)	

実施例番号	62	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52 (2H, d, J=6.9Hz), 7.46-7.39 (5H, m), 5.28 (2H, s), 4.38 (1H, m), 3.71 (1H, m), 2.60-2.15 (2H, m), 2.04-1.96 (4H, m), 1.30-1.20 (2H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	443 (M+1)	

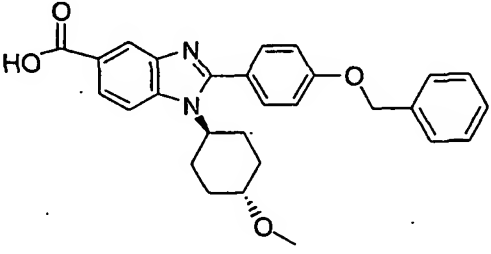
実施例番号	63	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96 (1H, d, J=8.4Hz), 7.71 (2H, d, J=9.0Hz), 7.51 (2H, d, J=6.9Hz), 7.46-7.37 (3H, m), 7.30 (2H, d, J=8.4Hz), 5.25 (3H, s), 4.39 (1H, m), 3.44 (1H, m), 3.27 (3H, s), 2.60-1.95 (6H, m), 1.25-1.05 (2H, m).
純度	約 90% (NMR)	
MS	457 (M+1)	

表 12

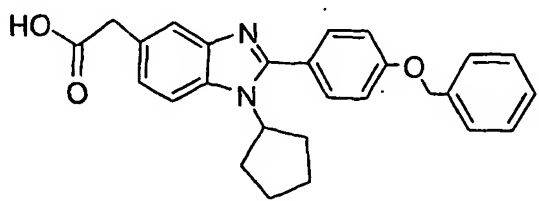
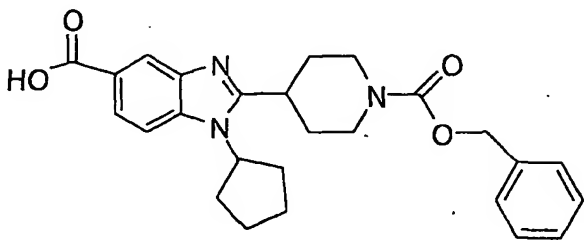
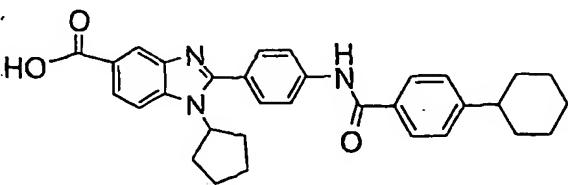
実施例番号	64	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.25 (1H, brs), 7.70-7.30 (9H, m), 7.20 (2H, d, J=8.7Hz), 7.14 (1H, d, J=8.4Hz), 5.20 (2H, s), 4.84 (1H, quint, J=6.0Hz), 3.66 (2H, s), 2.30-1.51 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	427 (M+1)	
実施例番号	65	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.64 (1H, brs), 8.13 (1H, s), 7.80 (1H, d, J=7.2Hz), 7.59 (1H, d, J=8.7Hz), 7.48-7.30 (5H, m), 5.11 (2H, s), 5.03 (1H, quint, J=8.7Hz), 4.20-4.05 (2H, m), 3.45-3.90 (3H, m), 2.15-1.60 (12H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	448 (M+1)	
実施例番号	66	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.59 (1H, s), 8.31 (1H, s), 8.10 (2H, d, J=8.6Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 8.00-7.85 (3H, m), 7.80 (2H, d, J=8.6Hz), 7.41 (2H, d, J=8.2Hz), 4.98 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.71-1.10 (19H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	508 (M+1)	

表 13

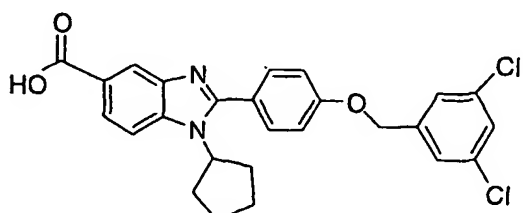
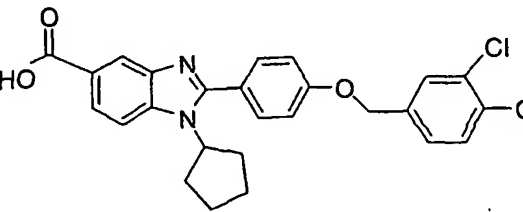
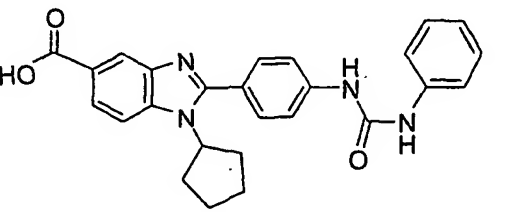
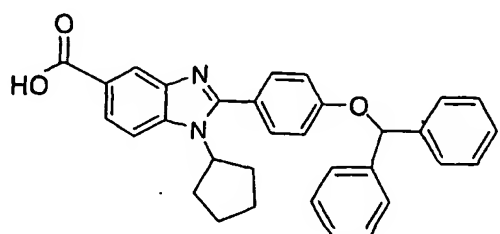
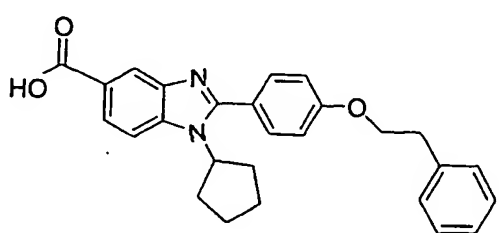
実施例番号	67	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.81 (1H, brs), 8.42 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.5Hz), 7.80 -7.52 (6H, m), 7.44 (2H, d, J= 8.6Hz), 5.25 (2H, s), 4.88 (1 H, quint, J=8.8Hz), 2.30-1. 52 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	481 (M+1)	
実施例番号	68	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.4Hz), 8.05 (1H, d, J=8.6Hz), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 8.86-8.61 (4H, m), 7.51 (1H, d, J=6.3Hz), 7.33 (2H, d, J=8.8Hz), 5.28 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=8.8Hz), 2.31-1.60 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	481 (M+1)	
実施例番号	69	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.88 (1H, s), 9.42 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.09 and 8.02 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.81 and 7.78 (4H, A' B' q, J=9.2Hz), 7.50 (2H, d, J=7.8Hz), 7.31 (2H, t, J=7.8Hz), 7.00 (1H, t, J=7.8Hz), 5.03 (1H, quint, J=8.7Hz), 2.34-2.17 (4H, m), 2.13-1.96 (2H, m), 1.83-1.64 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	441 (M+1)	

表 14

実施例番号	70	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, d, J=1.2Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.60-7.20 (12H, m), 6.74 (1H, s), 4.92 (1H, quint, J=8.9Hz), 2.30-1.58 (8H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	489 (M+1)	

実施例番号	71	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.76 (2H, d, J=8.6Hz), 7.44-7.19 (7H, m), 4.94 (1H, quint, J=8.8Hz), 4.35 (2H, t, J=6.7Hz), 3.10 (2H, t, J=6.7Hz), 2.32-1.60 (8H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	427 (M+1)	

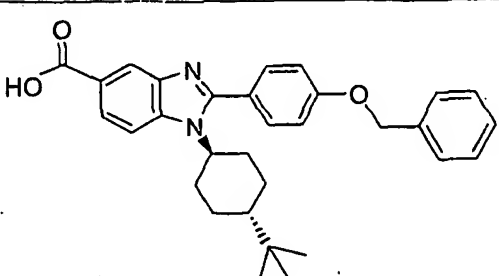
実施例番号	72	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.7Hz), 8.03 (1H, d, J=9.0Hz), 7.75 (2H, d, J=8.7Hz), 7.51 (2H, d, J=7.2Hz), 7.46-7.33 (5H, m), 5.27 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.50-2.25 (2H, m), 2.15-2.00 (2H, m), 1.95-1.85 (2H, m), 1.35 (1H, m), 1.20-1.10 (2H, m), 0.87 (9H, s)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	483 (M+1)	



表 15

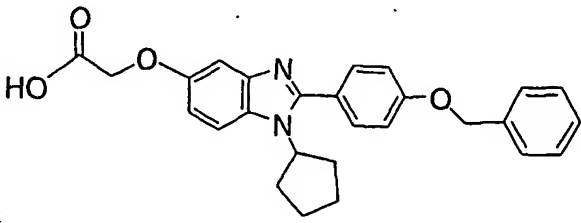
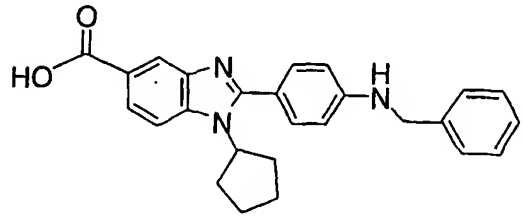
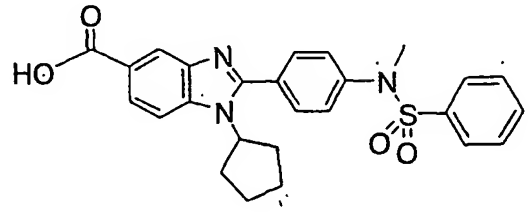
実施例番号	73	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 7.59 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.35 (6H, m), 7.20 (2H, d, J=8.7Hz), 7.14 (1H, d, J=2.1Hz), 6.90 (1H, dd, J=9.0, 2.4Hz), 5.21 (2H, s), 4.83 (1H, quint, J=8.7Hz), 4.70 (2H, s), 2.30-1.90 (6H, m), 1.75-1.55 (2H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	443 (M+1)	
実施例番号	74	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.06 and 7.97 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.57 and 6.86 (4H, A'B'q, J=8.9Hz), 7.42-7.26 (5H, m), 5.04 (1H, quint, J=9.0Hz), 4.42 (2H, s), 2.32-1.94 (6H, m), 1.80-1.62 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	412 (M+1)	
実施例番号	75	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, s), 8.26 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=9.2Hz), 7.76-7.60 (8H, m), 7.35 (2H, d, J=8.4Hz), 4.84 (1H, quint, J=8.8Hz), 3.23 (3H, s), 2.32-1.90 (6H, m), 1.78-1.61 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	476 (M+1)	

表 16

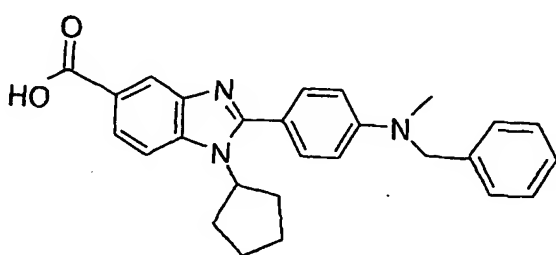
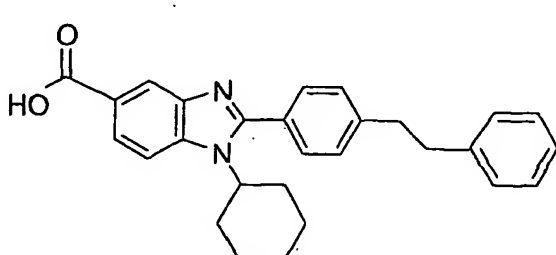
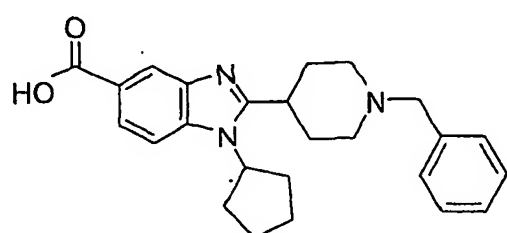
実施例番号	76	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.07 and 7.49 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.66 and 7.00 (4H, A' B' q, J=7.7Hz), 7.39-7.24 (5H, m), 5.05 (1H, quint, J=8.8Hz), 4.76 (2H, s), 3.21 (3H, s), 2.35-1.92 (6H, m), 1.81-1.62 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	426 (M+1)	
実施例番号	77	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.56 and 7.43 (4H, ABq, J=8.1Hz), 7.34-7.16 (5H, m), 4.25 (1H, brt, J=12.5Hz), 3.06-2.92 (4H, m), 2.41-2.17 (2H, m), 1.96-1.77 (4H, m), 1.72-1.58 (1H, m), 1.48-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	425 (M+1)	
実施例番号	78	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.14 (1H, s), 7.79 (1H, d, J=9.0Hz), 7.57 (1H, d, J=8.7Hz), 7.40-7.20 (5H, m), 4.89 (1H, quint, J=8.7Hz), 3.54 (2H, s), 3.19-2.90 (3H, m), 2.23-1.69 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	404 (M+1)	

表 17

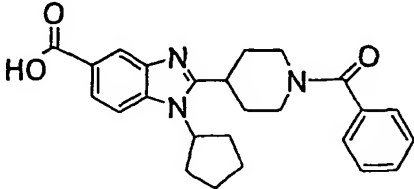
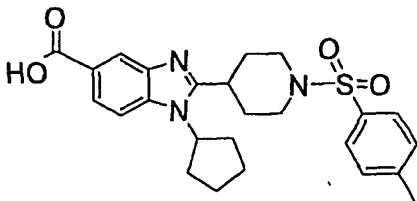
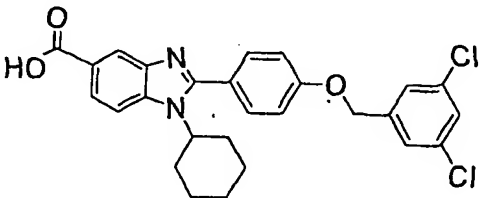
実施例番号	79	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.15 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=8.4Hz), 7.59 (1H, d, J=9.0Hz), 7.50-7.38 (5H, m), 5.05 (1H, quint, J=9.0Hz), 3.85-2.95 (3H, m), 2.20-1.65 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	418 (M+1)	
実施例番号	80	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.17 (1H, m), 7.84 (1H, d, J=8.4Hz), 7.78-7.62 (3H, m), 7.49 (2H, d, J=8.1Hz), 5.05-4.91 (1H, m), 3.80-3.70 (2H, m), 3.30-3.12 (1H, m), 2.48-2.31 (5H, m), 2.15-1.60 (12H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	468 (M+1)	
実施例番号	81	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, brs), 8.21 (1H, d, J=1.4Hz), 7.49 (1H, d, J=8.6Hz), 7.85 (1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.70-7.55 (5H, m), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 5.25 (2H, s), 4.36-4.15 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.48-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	495 (M+1)	

表 18

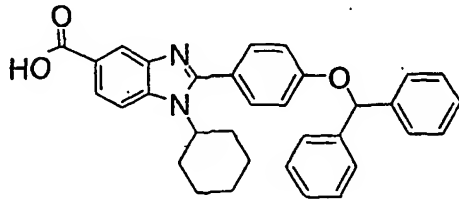
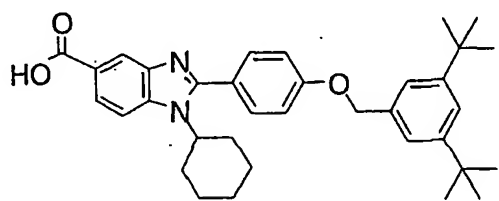
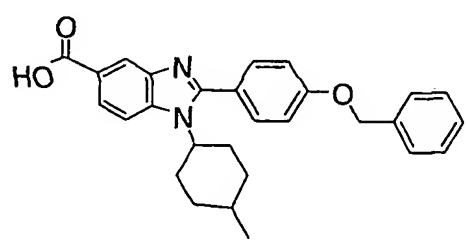
実施例番号	82	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 8.22 (1H, d, J=8.7Hz), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 (2H, d, J=8.7Hz), 7.60-7.50 (4H, m), 7.45-7.25 (8H, m), 6.75 (1H, s), 4.21-4.23 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 2.10-1.78 (4H, m), 1.70-1.15 (4H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	503 (M+1)	
実施例番号	83	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.2 (1H, brs), 8.30 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.74 (2H, d, J=8.6Hz), 7.40-7.33 (5H, m), 5.22 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.50-1.40 (10H, m), 1.31 (18H, s)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	539 (M+1)	
実施例番号	84	1H NMR (δ) ppm
		mixture of isomers (cis:trans=3:1) 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.20-7.95 (2H, m), 7.72 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.29 (7H, m), 5.25 (2H, s), 4.34, 3.40 (1H, m), 2.50-2.20 (2H, m), 2.05-1.50 (6H, m), 1.14, 0.90 (3H, d, J=6.9, 6.3Hz), 1.09 (1H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	441 (M+1)	

表 19

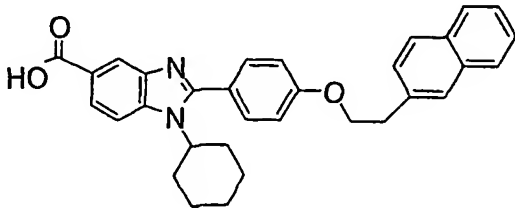
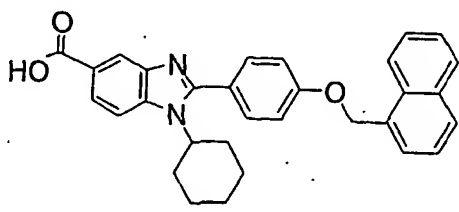
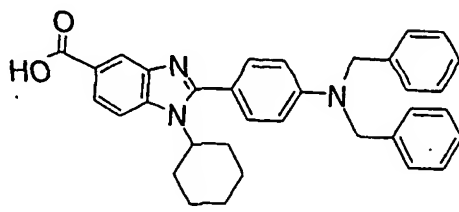
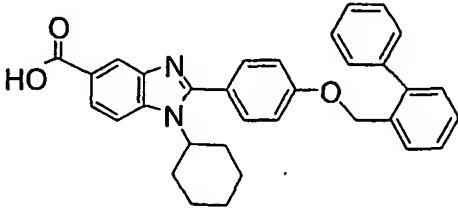
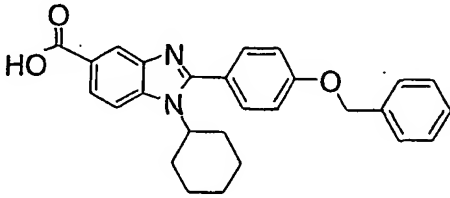
実施例番号	85	1H NMR ( $\delta$ ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.25 (1H, s), 8.14-7.83 (6H, m), 7.77-7.44 (5H, m), 7.21 (2H, d, J=7.8Hz), 4.44 (2H, brt), 4.31 (1H, brt), 3.56 (2H, brt), 2.20-2.16 (2H, m), 2.00-1.74 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.45-1.14 (3H, m)
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	491 (M+1)	
実施例番号	86	1H NMR ( $\delta$ ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=7.6Hz), 8.02-7.53 (10H, m), 7.32 (2H, d, J=8.7Hz), 5.68 (2H, s), 4.32 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.41-2.20 (2H, m), 2.01-1.78 (4H, m), 1.71-1.56 (1H, m), 1.50-1.16 (3H, m)
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	477 (M+1)	
実施例番号	87	1H NMR ( $\delta$ ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.75 (1H, brs), 8.16 (1H, s), 7.91 and 7.82 (2H, ABq, J=8.5Hz), 7.44 and 6.86 (4H, A' B' q, J=8.6Hz), 7.39-7.26 (10H, m), 4.82 (2H, s), 4.35 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.35-2.16 (2H, m), 1.97-1.75 (4H, m), 1.69-1.56 (1H, m), 1.45-1.16 (3H, m)
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	516 (M+1)	

表 20

実施例番号	88	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.26 and 8.06 (2H, ABq, J=8.9Hz), 7.73 and 7.22 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.50-7.36 (8H, m), 5.10 (2H, s), 4.37 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.38-2.28 (2H, m), 2.10-1.80 (4H, m), 1.70-1.56 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	503 (M+1)	

実施例番号	89	1H NMR (δ) ppm
		
純度	91% (HPLC)	
MS	427 (M+1)	

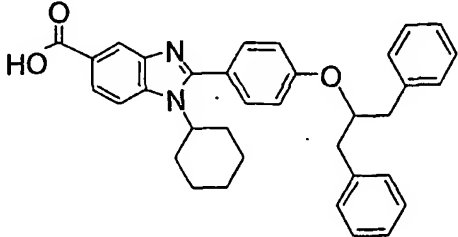
実施例番号	90	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.40-8.20 (2H, m), 8.04 (1H, d, J=8.4Hz), 7.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.50-7.10 (12H, m), 5.08 (1H, m), 4.33 (1H, m), 3.00 (4H, m), 2.50-1.10 (10H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	531 (M+1)	

表 21

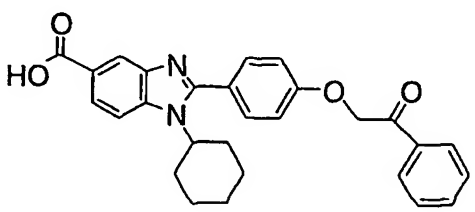
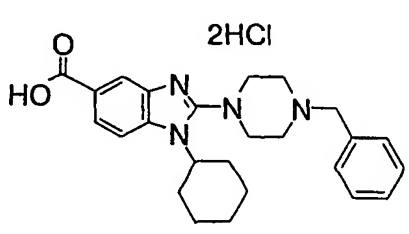
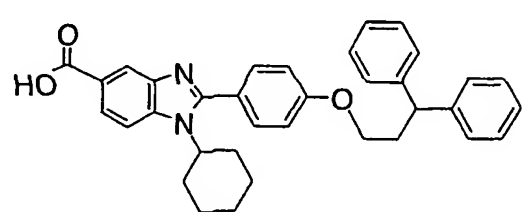
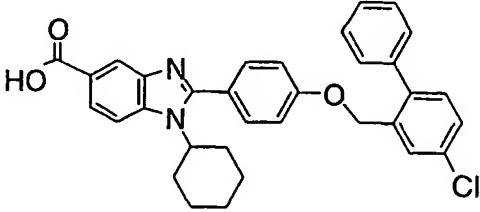
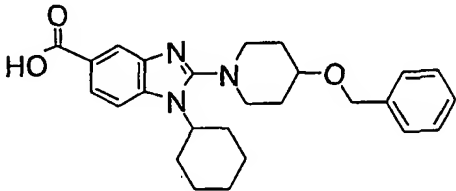
実施例番号	91	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.08-8.03 (3H, m), 7.77-7.58 (5H, m), 7.31 (2H, d, J=8.7Hz), 5.81 (2H, s), 4.40 (1H, m), 2.50-1.20 (10H, m).
純度	約90% (NMR)	
MS	455 (M+1)	
実施例番号	92	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 11.8 (1H, brs), 8.07 (1H, s), 7.89 (1H, d, J=8.7Hz), 7.84 (1H, d, J=8.4Hz), 7.69 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.42 (2H, s), 4.11 (1H, m), 3.73 (4H, m), 3.40 (4H, m), 2.40-1.40 (10H, m)
純度	>90% (NMR)	
MS	419 (M+1)	
実施例番号	93	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8.9Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.38 (4H, d, J=7.2Hz), 7.31 (4H, t, J=7.3Hz), 7.21-7.17 (4H, m), 4.37 (1H, m), 4.26 (1H, t, J=7.9Hz), 4.01 (2H, t, J=6.2Hz), 2.57 (2H, m), 2.50-2.20 (2H, m), 2.10-2.00 (2H, m), 2.00-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m).
純度	>90% (NMR)	
MS	531 (M+1)	

表 22

実施例番号	94	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.75-7.70 (3H, m), 7.56 (1H, d, J=8.4Hz), 7.55-7.35 (6H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	537 (M+1)	

実施例番号	95	1H NMR (δ) ppm
		300Hz, DMSO-d6 12.9 (1H, brs), 8.02 (1H, s), 7.82 (2H, m), 7.40-7.25 (5H, m), 4.58 (2H, s), 4.09 (1H, m), 3.71 (1H, m), 3.49 (2H, m), 3.21 (2H, m), 2.35-1.30 (14H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	434 (M+1)	

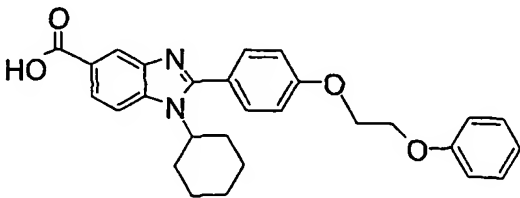
実施例番号	96	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.3Hz), 8.27 (1H, d, J=8.8Hz), 8.05 (1H, d, J=8.8Hz), 7.76 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40-7.25 (4H, m), 7.06-6.90 (3H, m), 4.53-4.26 (5H, m), 2.40-2.18 (2H, m), 2.12-1.56 (5H, m), 1.50-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	457 (M+1)	



表 23

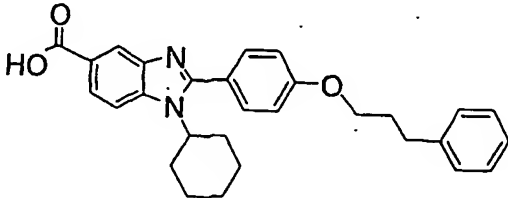
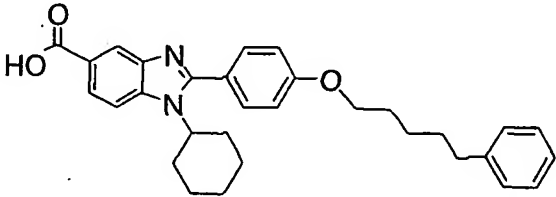
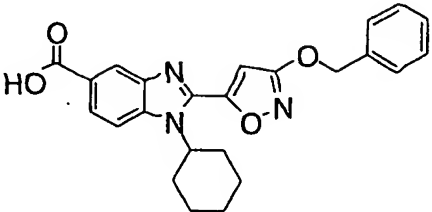
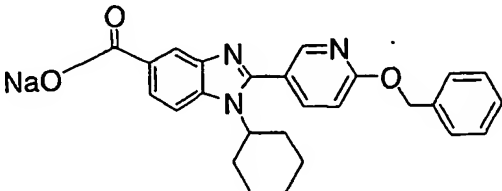
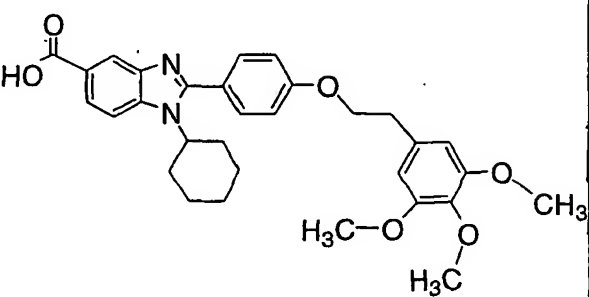
実施例番号	97	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, d, J=1.3Hz), 8.29 (1H, d, J=8.8Hz), 8.05 (1H, dd, J=8.8, 1.3Hz), 8.42 (2H, d, J=8.8Hz), 7.37-7.16 (7H, m), 4.48-4.30 (1H, m), 4.12 (2H, t, J=6.2Hz), 2.83-2.70 (2H, m), 2.40-1.50 (9H, m), 1.59-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	455 (M+1)	
		
実施例番号	98	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, d, J=1.3Hz), 8.21 (1H, d, J=8.8Hz), 8.01 (1H, d, J=10.1Hz), 7.70 (2H, d, J=8.7Hz), 7.33-7.12 (7H, m), 4.4-4.28 (1H, m), 4.10 (2H, t, J=6.3Hz), 2.62 (2H, t, J=7.4Hz), 2.39-2.15 (2H, m), 2.10-1.18 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	483 (M+1)	
		
実施例番号	99	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 12.93 (1H, brs), 8.30 (1H, d, J=1.4Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.92 (1H, dd, J=8.7, 1.4Hz), 7.59-7.34 (5H, m), 7.07 (1H, s), 5.38 (2H, s), 4.78-4.60 (1H, m), 2.32-2.14 (2H, m), 2.03-1.28 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	418 (M+1)	
		

表 24

実施例番号	100	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.46 (1H, d, J=2.1Hz), 8.16 (1H, s), 8.00 (1H, dd, J=8.5, 2.1Hz), 7.87 (1H, d, J=8.5Hz), 7.68 (1H, d, J=8.5Hz), 7.55-7.30 (5H, m), 7.08 (1H, d, J=8.5Hz), 5.45 (2H, s), 4.25-4.08 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.45-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	427 (M+1)	

実施例番号	101	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.33 (1H, s), 8.31 (1H, d, J=6.9Hz), 8.06 (1H, d, J=8.4Hz), 7.76 and 7.29 (4H, ABq, J=8.9Hz), 6.68 (2H, s), 4.37 (1H, m), 4.35 (2H, t, J=7.0Hz), 3.79 (6H, s), 3.63 (3H, s), 3.04 (2H, t, J=6.9Hz), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.65 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	531 (M+1)	

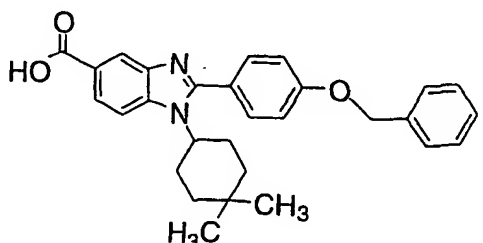
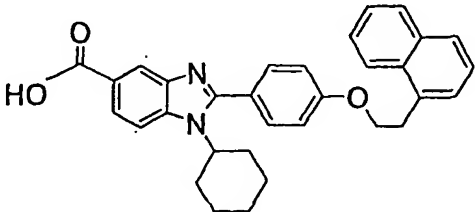
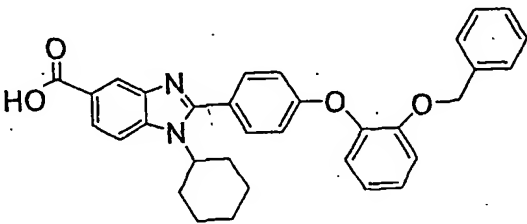
実施例番号	102	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.88 (1H, s), 8.34 (1H, s), 7.86 (1H, d, J=8.5Hz), 7.73 (1H, d, J=8.5Hz), 7.63 and 7.23 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.52-7.35 (5H, m), 5.22 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.39 (2H, m), 1.79 (2H, m), 1.53 (2H, m), 1.31 (2H, m), 1.11 (3H, s), 0.95 (3H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	455 (M+1)	

表 25

実施例番号	103	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.79 (1H, brs), 8.22 (2H, s), 8.02-7.78 (4H, m), 7.63-7.42 (6H, m), 7.20-7.09 (2H, m), 4.43 (2H, s), 4.27 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.59 (2H, s), 2.39-2.15 (2H, m), 1.98-1.72 (4H, m), 1.68-1.59 (1H, m), 1.43-1.12 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	491 (M+1)	

実施例番号	104	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.64 and 7.05 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.32-7.09 (9H, m), 5.13 (2H, s), 4.28 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.36-2.19 (2H, m), 1.95-1.77 (4H, m), 1.66-1.56 (1H, m), 1.46-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	519 (M+1)	

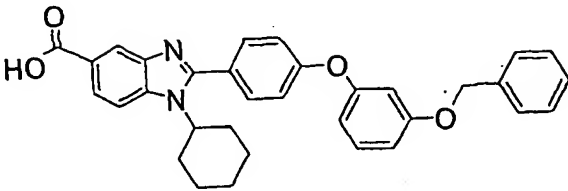
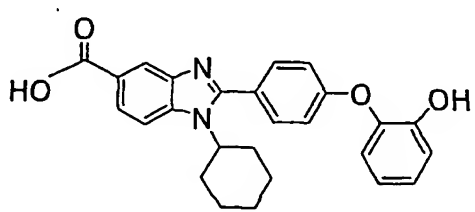
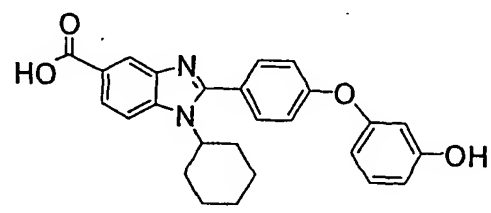
実施例番号	105	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.68 and 7.17 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.46-7.33 (6H, m), 6.93 and 6.75 (2H, A''B''q, J=8.2Hz), 6.82 (1H, s), 5.13 (2H, s), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.39-2.18 (2H, m), 1.98-1.77 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.48-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	519 (M+1)	

表 26

実施例番号	106	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.89 (1H, brs), 9.73 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.03 and 7.91 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.66 and 7.04 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.16-7.03 (3H, m), 6.89 (2H, t, J=9.2Hz), 4.33 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.40-2.18 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	429 (M+1)	

実施例番号	107	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.98 (1H, brs), 9.82 (1H, brs), 8.27 (1H, s), 8.09 and 7.94 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.74 and 7.22 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.28-7.22 (1H, m), 6.67-6.54 (3H, m), 4.35 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2.05-1.80 (4H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	429 (M+1)	

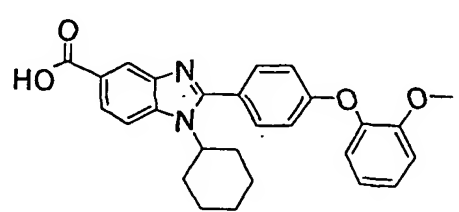
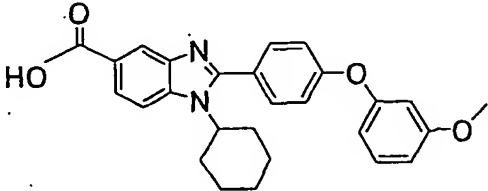
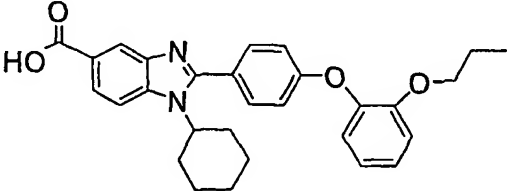
実施例番号	108	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, s), 8.01 and 7.90 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.65 and 7.03 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.32-7.20 (3H, m), 7.08-7.03 (1H, m), 4.32 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.77 (3H, s), 2.36-2.20 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.44-1.11 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	443 (M+1)	

表 27

実施例番号	109	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.24 (1H, s), 7.96 and 7.87 (2H, ABq, J=9.0 Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A' B' q, J=8.6 Hz), 7.37 (1H, t, J=7.1 Hz), 6.84-6.70 (3H, m), 4.31 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.78 (3H, s), 2.39-2.20 (2H, m), 1.98-1.78 (4H, m), 1.76-1.60 (1H, m), 1.48-1.13 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	443 (M+1)	

実施例番号	110	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.26 and 8.04 (2H, ABq, J=8.8 Hz), 7.75 and 7.71 (4H, A' B' q, J=8.8 Hz), 7.32-7.03 (4H, m), 4.34 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.94 (2H, t, J=6.3 Hz), 2.40-2.19 (2H, m), 2.11-1.81 (4H, m), 1.72-1.16 (6H, m), 0.71 (3H, t, J=7.3 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	471 (M+1)	

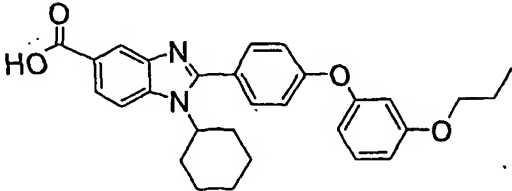
実施例番号	111	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.91 and 7.87 (2H, ABq, J=8.7 Hz), 7.68 and 7.18 (4H, A' B' q, J=8.7 Hz), 7.35 (1H, t, J=8.5 Hz), 6.80 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.72-6.68 (2H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.94 (2H, t, J=6.5 Hz), 2.39-2.18 (2H, m), 1.97-1.58 (7H, m), 1.45-1.20 (3H, m), 0.97 (3H, t, J=7.4 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	471 (M+1)	

表 28

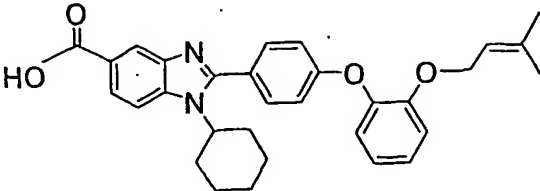
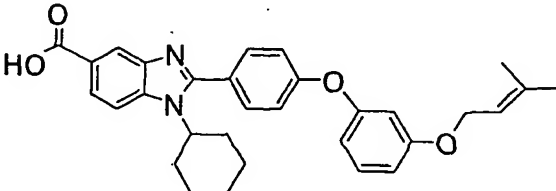
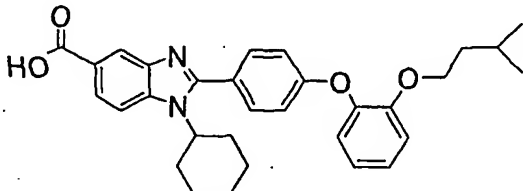
実施例番号	112	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.73 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.94 and 7.85 (2H, ABq, J=9.3 Hz), 7.61 and 7.01 (4H, A'B'q, J=8.6 Hz), 7.25-7.00 (4H, m), 5.25 (2H, brs), 4.55 (2H, d, J=6.6 Hz), 4.29 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.38-2.18 (2H, m), 1.96-1.78 (4H, m), 1.70-1.56 (1H, m), 1.67 (3H, s), 1.60 (3H, s), 1.48-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	497 (M+1)	
実施例番号	113	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.9 Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.9 Hz), 7.35 (1H, t, J=8.3 Hz), 6.81-6.69 (3H, m), 5.41 (2H, brs), 4.54 (2H, d, J=6.6 Hz), 4.31 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.41-2.18 (2H, m), 1.98-1.76 (4H, m), 1.73 (3H, s), 1.70-1.58 (1H, m), 1.68 (3H, s), 1.45-1.17 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	497 (M+1)	
実施例番号	114	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.73 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.94 and 7.85 (2H, ABq, J=8.4 Hz), 7.60 and 6.99 (4H, A'B'q, J=8.6 Hz), 7.29-7.00 (4H, m), 4.29 (1H, brt, J=12.2 Hz), 3.99 (2H, t, J=6.3 Hz), 2.41-2.20 (2H, m), 1.95-1.76 (4H, m), 1.70-1.14 (7H, m), 0.76 (3H, d, J=6.6 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	499 (M+1)	

表 29

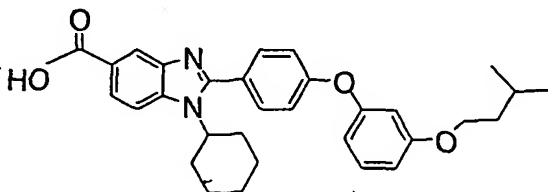
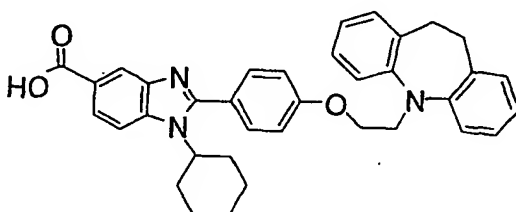
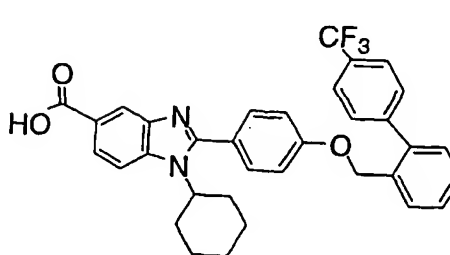
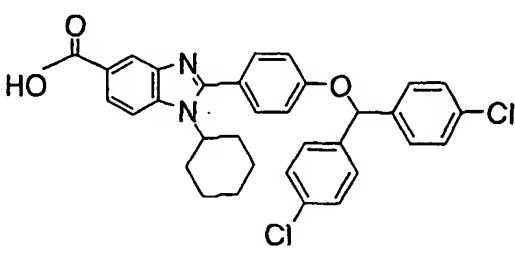
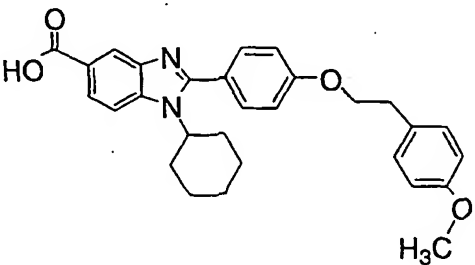
実施例番号	115	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.23 (1H, s), 7.93 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.35 (1H, t, J=7.8Hz), 6.82-6.69 (3H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 4.00 (2H, t, J=6.9Hz), 2.38-2.20 (2H, m), 1.97-1.54 (8H, m), 1.47-1.20 (3H, m), 0.93 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	499 (M+1)	
実施例番号	116	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.9Hz), 8.03 (1H, d, J=8.8Hz), 7.68 (2H, d, J=8.8Hz), 7.24 (2H, d, J=7.2Hz), 7.19-7.10 (6H, m), 6.94 (2H, t, J=7.2Hz), 4.34 (1H, m), 4.19 (4H, brs), 3.10 (4H, brs), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	557 (M+1)	
実施例番号	117	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.8 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.80 (2H, d, J=8.2Hz), 7.72-7.67 (3H, m), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.54-7.51 (2H, m), 7.42-7.41 (1H, m), 7.11 (2H, d, J=8.8Hz), 5.09 (2H, s), 4.27 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	571 (M+1)	

表 30

実施例番号	118	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.3 (1H, brs), 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.9Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.8Hz), 7.57 (4H, d, J=8.6Hz), 7.47 (4H, d, J=8.6Hz), 7.33 (2H, d, J=8.9Hz), 6.84 (1H, s), 4.33 (1H, m), 2.45-2.10 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.95-1.70 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	571 (M+1)	

実施例番号	119	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32-8.30 (2H, m), 8.07-8.03 (1H, m), 7.74 and 6.90 (4H, ABq, J=8.7Hz), 4.37 (1H, m), 4.31 (2H, t, J=6.8Hz), 3.74 (3H, s), 3.04 (2H, t, J=6.7Hz), 2.30 (2H, m), 2.02 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.63 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	471 (M+1)	

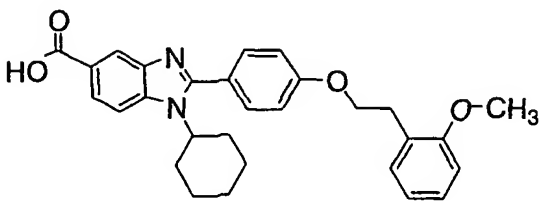
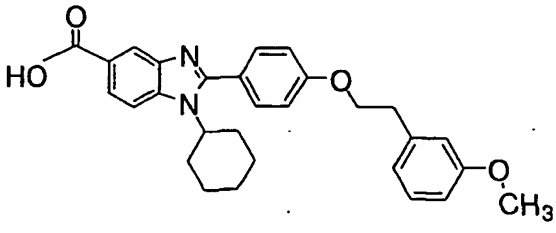
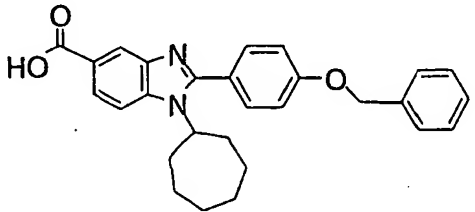
実施例番号	120	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.61 and 7.16 (4H, ABq, J=8.6Hz), 7.30-7.22 (2H, m), 7.01 (2H, d, J=8.1Hz), 6.92 (1H, t, J=7.5Hz), 4.28 (1H, m), 4.25 (2H, t, J=7.2Hz), 3.83 (3H, s), 3.07 (2H, t, J=7.1Hz), 2.28 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	471 (M+1)	



表 31

実施例番号	121	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.85 (1H, brs), 8.24 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.7Hz), 7.90 (1H, d, J=8.6Hz), 7.62 and, 7 .17 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.24 (1H, m), 6.94 (2H, m), 6.82 (1 H, m), 4.32 (2H, t, J=6.7Hz), 3.76 (3H, s), 3.07 (2H, t, J=6 .7Hz), 2.29 (2H, m), 2.00-1. 75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m) , 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	471 (M+1)	

実施例番号	122	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.8 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.87 (2H, m), 7.62 (2H, d, J=8 .1Hz), 7.60-7.20 (7H, m), 5. 23 (2H, s), 4.46 (1H, m), 2.50 -2.30 (2H, m), 1.70-1.40 (10 H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	441 (M+1)	

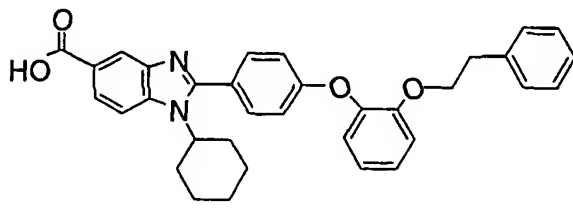
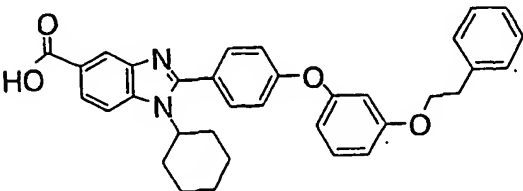
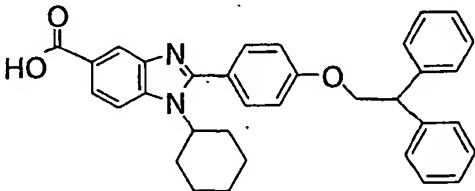
実施例番号	123	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=9 .0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.4Hz) , 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40 -7.05 (9H, m), 7.03 (2H, d, J= 8.4Hz), 4.31 (1H, m), 4.18 (2 H, t, J=6.6Hz), 2.81 (2H, t, J =6.3Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2.00-1.70 (4H, m), 1.70-1.5 0 (1H, m), 1.50-1.05 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	533 (M+1)	

表 32

実施例番号	124	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.1 (1H, brs), 8.29 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.7Hz), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40-7.20 (8H, m), 6.84 (1H, d, J=9.3Hz), 6.75-6.72 (2H, m), 4.36 (1H, m), 4.22 (2H, t, J=6.8Hz), 3.04 (2H, t, J=6.7Hz), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	533 (M+1)	

実施例番号	125	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=9.0Hz), 7.73 (2H, d, J=9.0Hz), 7.43 (4H, d, J=7.2Hz), 7.36-7.20 (8H, m), 4.74 (2H, d, J=7.5Hz), 4.57 (1H, t, J=7.5Hz), 4.38 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.85 (2H, m), 1.85-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	517 (M+1)	

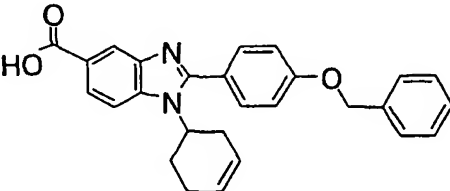
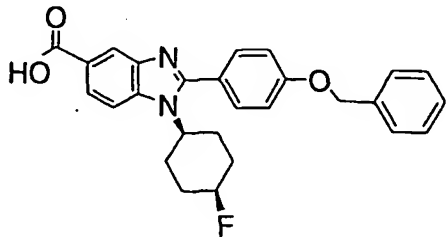
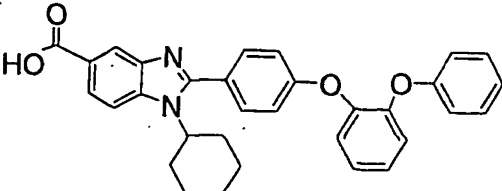
実施例番号	126	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.7Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=9.0Hz), 7.52-7.31 (7H, m), 5.74 (2H, m), 5.26 (2H, s), 4.61 (1H, m), 2.96 (1H, m), 2.60-2.10 (5H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	425 (M+1)	

表 33

実施例番号	127	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.2 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96 (1H, d, J=8.8Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.52-7.32 (7H, m), 5.26 (2H, s), 4.92 (1H, d, J=49.4Hz), 4.57 (1H, m), 2.65-2.35 (2H, m), 2.25-1.50 (6H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	445 (M+1)	

実施例番号	128	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.92 and 7.85 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.61 and 7.06 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.36-6.91 (9H, m), 4.24 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.35-2.15 (2H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.14 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	505 (M+1)	

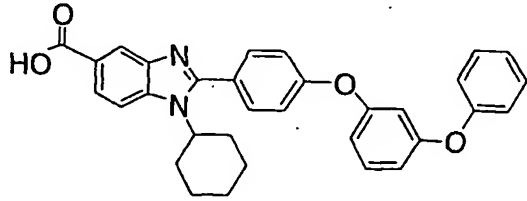
実施例番号	129	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.92 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.22 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.52-7.39 (1H, m), 7.47 and 7.41 (2H, A''B''q, J=8.1Hz), 6.91 (1H, d, J=8.0Hz), 6.89 (1H, d, J=8.2Hz), 6.75 (1H, s), 4.36-4.18 (1H, m), 2.38-2.17 (2H, m), 1.95-1.76 (4H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.44-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	505 (M+1)	

表 34

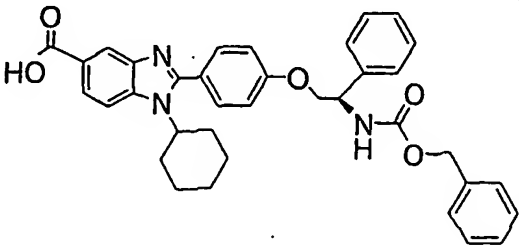
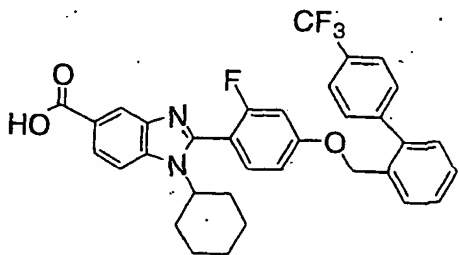
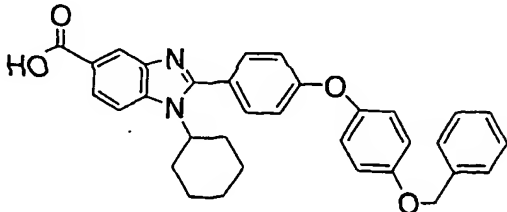
実施例番号	130	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, s), 7.69 (2H, d, J=8.6Hz), 7.49-7.21 (11H, m), 5.08 and 5.03 (2H, ABq, J=12.6Hz), 5.07-4.99 (1H, m), 4.26 (2H, d, J=6.6Hz), 2.40-2.18 (2H, m), 2.04-1.77 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	590 (M+1)	
実施例番号	131	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=9.0Hz), 7.96 (1H, d, J=8.4Hz), 7.80 (2H, d, J=8.1Hz), 7.72-7.41 (7H, m), 7.12 (1H, d, J=12.6Hz), 7.01 (1H, d, J=8.4Hz), 5.12 (2H, s), 4.06 (1H, m), 2.35-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.60-1.20 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	589 (M+1)	
実施例番号	132	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.8 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.66 (2H, d, J=8.6Hz), 7.49-7.33 (5H, m), 7.17-7.05 (6H, m), 5.12 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.20 (8H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	519 (M+1)	

表 35

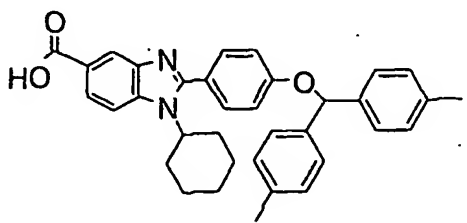
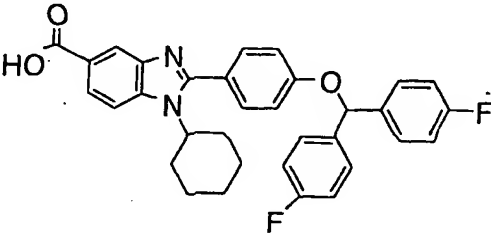
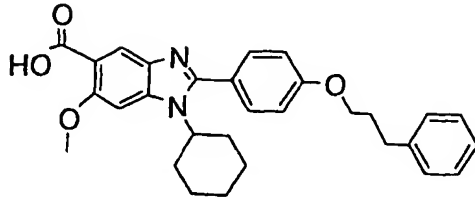
実施例番号	133	1H NMR( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.57(1H, s), 8.01(1H, d, J=8.7Hz), 7.66(1H, d, J=8.7Hz), 7.51(2H, d, J=8.7Hz), 7.31(4H, d, J=8.0Hz), 7.16(4H, d, J=8.0Hz), 7.09(2H, d, J=8.7Hz), 6.26(1H, s), 4.37(1H, m), 2.41-2.28(2H, m), 2.33(6H, s), 2.03-1.84(4H, m), 1.77(1H, m), 1.45-1.20(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	531 (M+1)	
実施例番号	134	1H NMR( $\delta$ ) ppm
		8.59(1H, d, J=1.5Hz), 8.02(1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.68(1H, d, J=8.7Hz), 7.54(2H, d, J=8.8Hz), 7.39(4H, dd, J=8.7, 5.3Hz), 7.08(4H, d, J=8.7Hz), 7.05(2H, d, J=8.8Hz), 6.29(1H, s), 4.36(1H, m), 2.43-2.19(2H, m), 2.04-1.85(4H, m), 1.78(1H, m), 1.45-1.23(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	539 (M+1)	
実施例番号	135	1H NMR( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.34(1H, brs), 7.93(1H, s), 7.55(1H, d, J=8.6Hz), 7.33-7.15(6H, m), 7.11(2H, d, J=8.6Hz), 4.30-4.20(1H, m), 4.07(2H, t, J=6.3Hz), 3.93(3H, s), 2.78(2H, t, J=7.4Hz), 2.35-2.19(2H, m), 2.12-2.00(2H, m), 1.91-1.79(4H, m), 1.69-1.60(1H, m), 1.47-1.20(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	485 (M+1)	

表 36

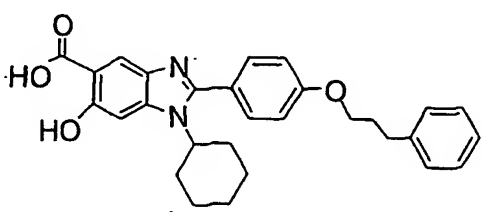
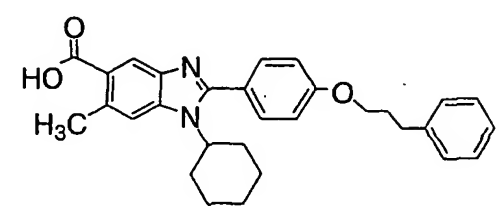
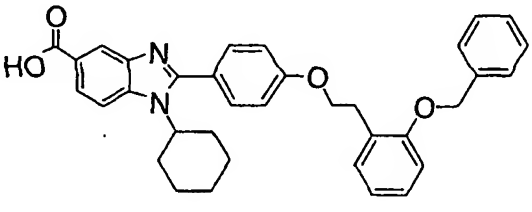
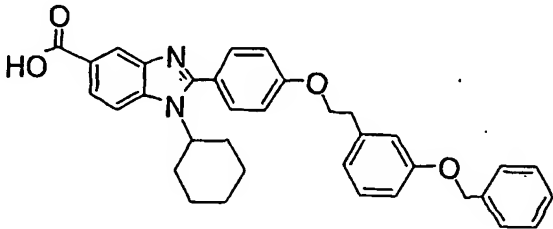
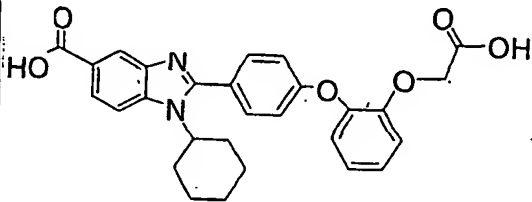
実施例番号	136	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.13 (1H, s), 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.63 (1H, s), 7.35-7.12 (7H, m), 4.35-4.20 (1H, m), 4.10 (1H, t, J=6.3Hz), 2.78 (2H, t, J=7.5Hz), 2.33-1.78 (8H, m), 1.70-1.16 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	471 (M+1)	
実施例番号	137	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.24 (1H, s), 8.11 (1H, s), 7.76 (2H, d, J=9.0Hz), 7.37-7.16 (7H, m), 4.43-4.30 (1H, m), 4.13 (2H, t, J=6.3Hz), 2.84-2.68 (5H, m), 2.42-2.22 (2H, m), 2.18-1.80 (6H, m), 1.70-1.20 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	469 (M+1)	
実施例番号	138	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.73 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.76 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.54-7.49 (4H, m), 7.42-7.21 (5H, m), 7.11-7.09 (3H, m), 6.93 (1H, m), 5.17 (2H, s), 4.29 (3H, m), 3.11 (2H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 1.99-1.23 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	547 (M+1)	

表 37

実施例番号	139	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.73 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.73 (1H, m), 7.60-7.57 (2H, m), 7 .47-6.90 (1H, m), 5.11 (2H, s ) , 4.33-4.28 (3H, m), 3.09-3 .04 (2H, t, J=6.7Hz), 2.35-2 .20 (2H, m), 1.95-1.10 (8H, m )
純度	> 90% (NMR)	
MS	547 (M+1)	

実施例番号	140	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.83 (2H, brs), 8.22 (1H, s) , 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, d, J=8.4Hz), 7.63-7.60 (2H, m), 7.26-7.03 (6H, m), 4 .73 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.4 0-2.15 (2H, m), 2.00-1.20 (8 H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	487 (M+1)	

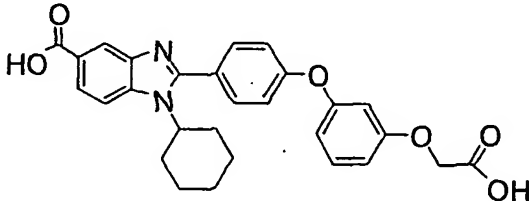
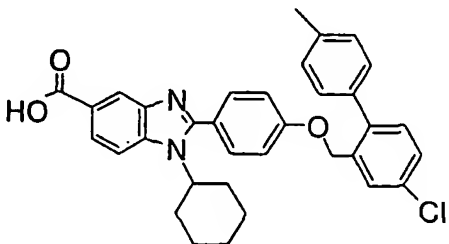
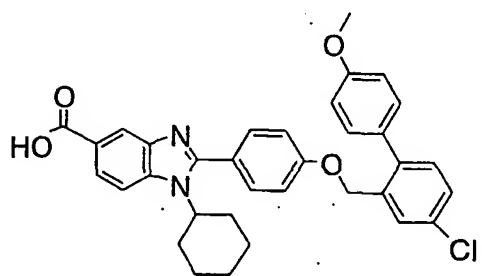
実施例番号	141	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.87 (1H, brs), 8.24 (1H, s) , 7.97 (1H, d, J=9.0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 and 7. 19 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.36 (1 H, t, J=8.7Hz), 6.80-6.72 (3 H, m), 4.71 (2H, s), 4.32 (1H , m), 2.29 (2H, m), 1.95-1.25 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	487 (M+1)	

表 38

実施例番号	142	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=9.0Hz), 7.76-7.72 (3H, m), 7.54 (1H, d, J=8.4Hz), 7.39-7.22 (7H, m), 5.11 (1H, s), 4.36 (1H, m), 2.35 (3H, s), 2.35-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	551 (M+1)	

実施例番号	143	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.1 (1H, brs), 8.30 (1H, s), 8.24 (1H, d, J=8.8Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 7.74-7.71 (3H, m), 7.52 (1H, d, J=8.3Hz), 7.40-7.36 (3H, m), 7.23 (2H, d, J=8.8Hz), 7.01 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.79 (3H, s), 2.45-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	567 (M+1)	

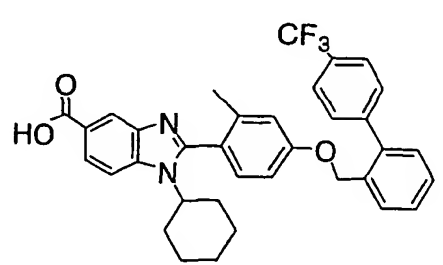
実施例番号	144	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.0 (1H, brs), 8.31 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.7Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (2H, d, J=8.3Hz), 7.70-7.66 (3H, m), 7.55-7.40 (4H, m), 7.03-6.95 (2H, m), 5.08 (2H, s), 4.03 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.18 (3H, s), 2.05-1.70 (4H, m), 1.70-1.50 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	585 (M+1)	



表 39

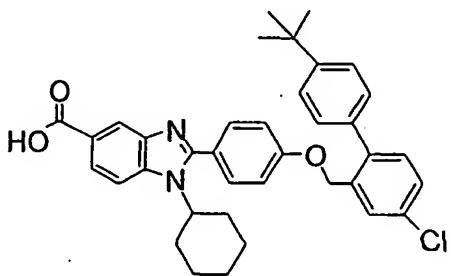
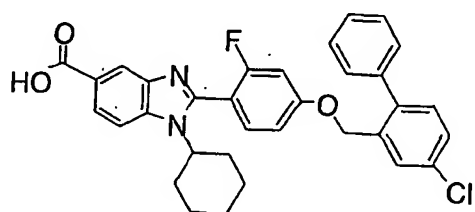
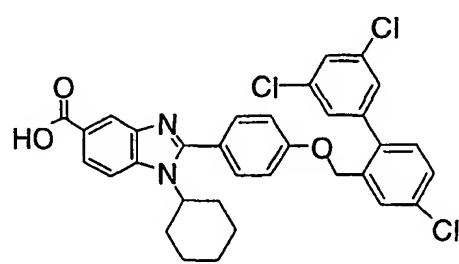
実施例番号	145	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.31 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.73-7.71 (3H, m), 7.54 (1H, d, J=8.3Hz), 7.48 (2H, d, J=8.4Hz), 7.41-7.37 (3H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.34 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m), 1.31 (9H, s).
純度	> 90% (NMR)	
MS	593 (M+1)	
実施例番号	146	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.6Hz), 7.76 (1H, d, J=2.1Hz), 7.63 (1H, t, J=8.5Hz), 7.57 (1H, d, J=8.2, 2.2Hz), 7.55-7.35 (6H, m), 7.15 (1H, d, J=12.1Hz), 7.02 (1H, d, J=8.6Hz), 5.10 (2H, s), 4.07 (1H, m), 2.35-2.10 (2H, m), 2.00-1.70 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	555 (M+1)	
実施例番号	147	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl <sub>3</sub> 8.61 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 (1H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, d, J=2.4Hz), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.42 (1H, d, J=8.0, 2.4Hz), 7.38 (1H, t, J=1.8Hz), 7.28 (2H, d, J=1.8Hz), 7.26 (1H, d, J=8.0Hz), 7.03 (2H, d, J=8.7Hz), 4.94 (2H, s), 4.37 (1H, m), 2.43-2.21 (2H, m), 2.17-1.86 (4H, m), 1.79 (1H, m), 1.43-1.26 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	605 (M+1)	

表 40

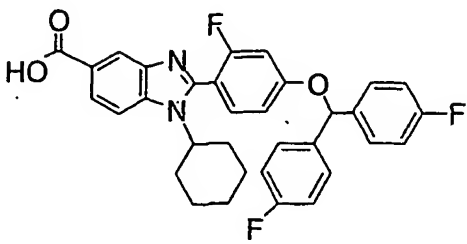
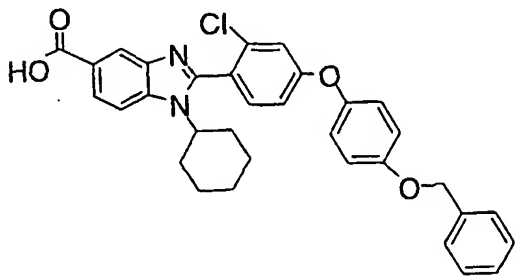
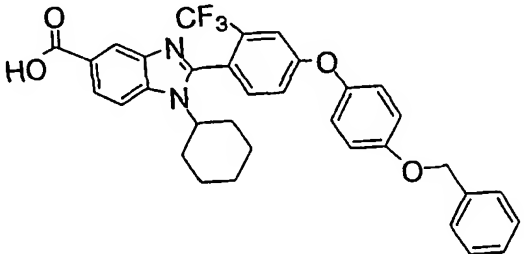
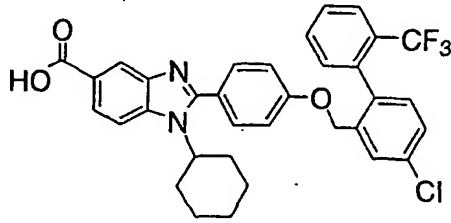
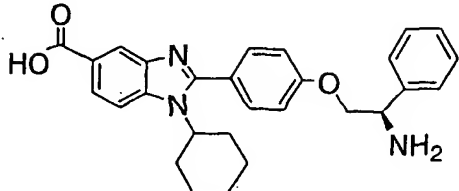
実施例番号	148	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (s, 1H), 7.89 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.63-7.46 (5H, m), 7.30-7.12 (5H, m), 7.08 (1H, d, J=11.0Hz), 6.81 (1H, s), 3.92 (1H, m), 2.15-2.06 (2H, m), 1.89-1.72 (4H, m), 1.61 (1H, m), 1.42-1.09 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	557 (M+1)	
実施例番号	149	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, d, J=1.5Hz), 7.96 (1H, d, J=9.0Hz), 7.88 (1H, dd, J=9.0, 1.5Hz), 7.58 (1H, d, J=8.7Hz), 7.50-7.30 (5H, m), 7.22-7.00 (6H, m), 5.13 (2H, s), 3.98-3.80 (1H, s), 2.36-1.10 (10H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	553 (M+1)	
実施例番号	150	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 8.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.88 (1H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.28 (7H, m), 7.23 (2H, d, J=9.3Hz), 7.14 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 3.90-3.72 (1H, m), 2.20-1.10 (10H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	587 (M+1)	

表 41

実施例番号	151	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.18 (1H, s), 7.92-7.78 (3H, m), 7.78-7.58 (3H, m), 7.58-7.44 (4H, m), 7.29 (1H, d, J=8.2Hz), 7.01 (2H, d, J=8.7Hz), 4.88 (1H, d, J=11.8Hz), 4.80 (1H, d, J=11.8Hz), 4.22 (1H, m), 2.37-2.16 (2H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.48-1.14 (3H, m).
純度	> 90 % (NMR)	
MS	605 (M+1)	

実施例番号	152	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (2H, m), 7.99-7.80 (2H, m), 7.63-7.08 (9H, m), 4.20-3.98 (4H, m), 2.20-2.15 (2H, m), 1.95-1.74 (4H, m), 1.70-1.54 (1H, m), 1.44-1.14 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	456 (M+1)	

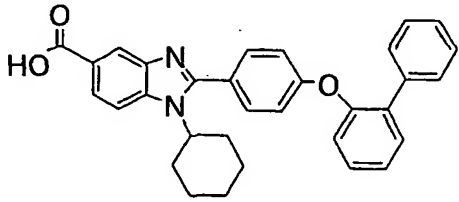
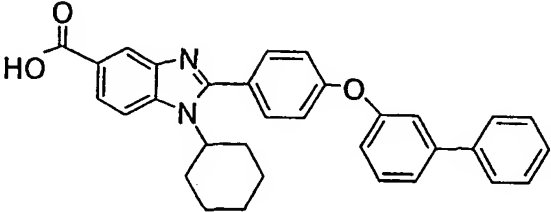
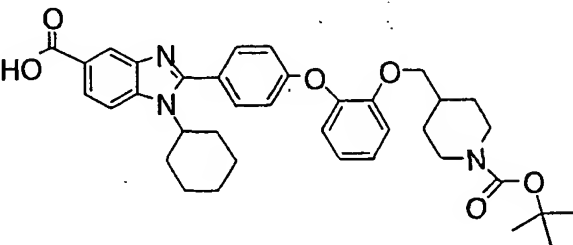
実施例番号	153	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.20 (1H, s), 8.93 and 7.83 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.86-7.21 (11H, m), 7.03 (2H, d, J=8.7Hz), 4.20 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.32-2.13 (2H, m), 1.92-1.74 (4H, m), 1.69-1.58 (1H, m), 1.45-1.15 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	489 (M+1)	

表 42

実施例番号	154	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.72-7.16 (13H, m), 5.25 (2H, brs), 4.55 (2H, d, J=6.6Hz), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.37-2.18 (2H, m), 1.98-1.77 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	489 (M+1)	

実施例番号	155	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.85 and 7.61 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.61 and 6.99 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.28-7.18 (1H, m), 7.25 (2H, d, J=7.5Hz), 7.07-6.99 (1H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.83 (2H, d, J=6.0Hz), 3.82-3.72 (1H, m), 2.68-2.49 (2H, m), 2.39-2.21 (2H, m), 1.95-1.80 (4H, m), 1.79-1.60 (2H, m), 1.46-1.22 (5H, m), 1.30 (9H, s), 1.00-0.82 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	

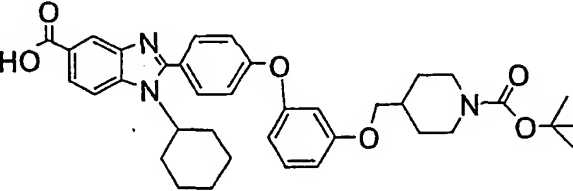
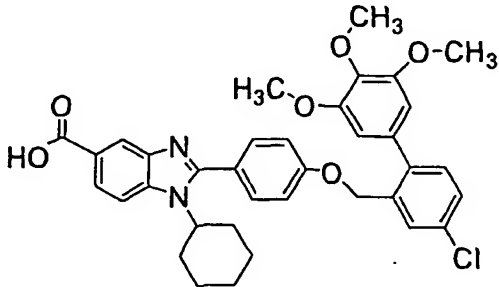
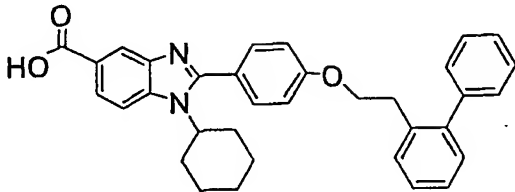
実施例番号	156	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.92 and 7.86 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.68 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.35 (1H, t, J=8.5Hz), 6.80 (1H, d, J=8.3Hz), 6.72-6.70 (2H, m), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.99 (2H, brd, J=12.0Hz), 3.85 (2H, d, J=6.3Hz), 2.82-2.62 (2H, m), 2.38-2.20 (2H, m), 1.99-1.59 (8H, m), 1.42-1.03 (5H, m), 1.39 (9H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	

表 43

実施例番号	157	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.78 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.75 (1H, d, J=2.2Hz), 7.60 (2H, d, J=8. 4Hz), 7.55 (1H, dd, J=8.3, 2. 2Hz), 7.48 (1H, d, J=8.3Hz), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.73 ( 2H, s), 5.08 (2H, s), 4.23 (1H , m), 3.68 (9H, s), 2.37-2.17 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1. 65 (1H, s), 1.49-1.15 (3H, m).
純度	> 90 % (NMR)	
MS	627 (M+1)	

実施例番号	158	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, brs), 8.22 (1H, s) , 7.93 (2H, d, J=8.7Hz), 7.85 (2H, d, J=8.5Hz), 7.53-7.21 (10H, m), 6.94 (2H, d, J=8.7H z), 4.30-4.12 (3H, m), 3.05 ( 2H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 1. 95-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 ( 1H, m), 1.50-1.10 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	517 (M+1)	

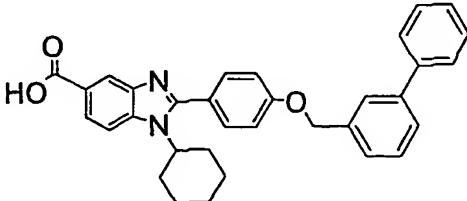
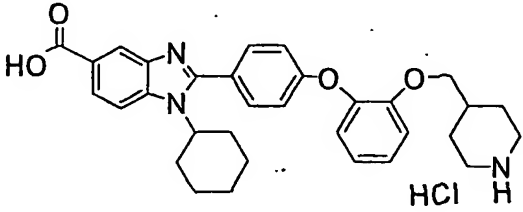
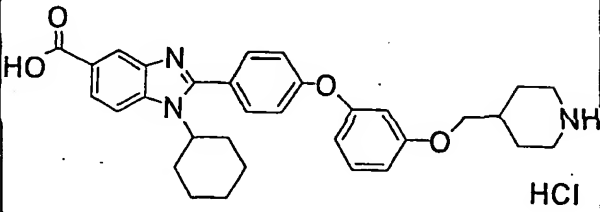
実施例番号	159	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.77 (1H, brs), 8.22 (1H, s) , 7.95 (1H, d, 8.6Hz), 7.86 (1 H, d, 8.6Hz), 7.80 (1H, s), 7. 70-7.35 (10H, m), 7.27 (2H, d , J=8.7Hz), 5.30 (2H, s), 4.2 8 (1H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.70-1.5 5 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	503 (M+1)	

表 44

実施例番号	160	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.90 (1H, brs), 8.59 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.18 and 8.00 (2H, ABq, J=8.5Hz), 7.73 and 7.10 (4H, A' B' q, J=8.5Hz), 7.32-7.05 (4H, m), 4.35 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.86 (2H, d, J=6.3Hz), 3.25-3.08 (2H, m), 2.85-2.66 (2H, m), 2.40-2.28 (2H, m), 2.07-1.14 (15H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	526 (M+1)	

実施例番号	161	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.05 (1H, brs), 8.76 (1H, brs), 8.31 (1H, s), 8.19 and 8.00 (2H, ABq, J=8.3Hz), 7.79 and 7.25 (4H, A' B' q, J=8.3Hz), 7.39 (1H, brs), 6.86-6.74 (4H, m), 4.37 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.89 (2H, d, J=5.0Hz), 3.35-3.18 (2H, m), 2.98-2.75 (2H, m), 2.38-2.17 (2H, m), 2.16-1.15 (15H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	526 (M+1)	

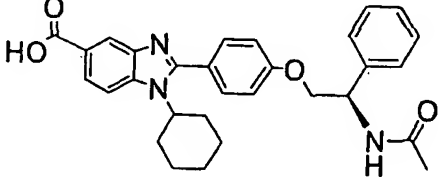
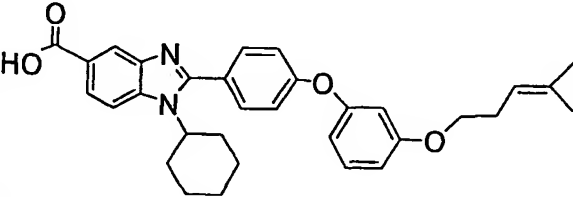
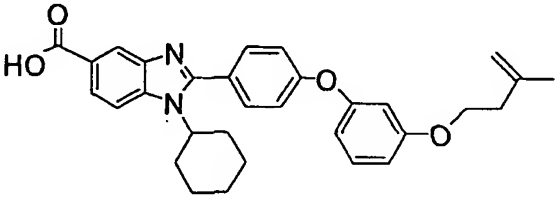
実施例番号	162	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.87 (1H, brs), 8.58 (1H, d, J=6.0Hz), 8.23 (1H, s), 7.99 and 7.80 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.61 and 7.18 (4H, A' B' q, J=8.0Hz), 7.45-7.30 (5H, m), 5.29 (1H, brs), 4.26 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.37-2.11 (2H, m), 2.00-1.71 (4H, m), 1.92 (3H, s), 1.70-1.52 (1H, m), 1.45-1.11 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	498 (M+1)	

表 45

実施例番号	163	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.35 (1H, t, J=8.6Hz), 6.80 (1H, d, J=7.5Hz), 6.72-6.69 (2H, m), 5.20 (1H, t, J=3.7Hz), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.95 (2H, t, J=6.8Hz), 2.49-2.19 (4H, m), 1.97-1.76 (4H, m), 1.68 (3H, s), 1.67-1.54 (1H, m), 1.61 (3H, s), 1.45-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	511 (M+1)	

実施例番号	164	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.20 (1H, s), 7.87 (2H, s), 7.68 and 7.18 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.35 (1H, t, J=7.9Hz), 6.81 (1H, d, J=9.4Hz), 6.72 (1H, s), 6.71 (1H, d, J=6.8Hz), 4.80 (2H, s), 4.29 (1H, brt, J=12.2Hz), 4.10 (1H, t, J=6.7Hz), 2.43 (1H, t, J=6.7Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 1.97-1.78 (4H, m), 1.76 (3H, s), 1.70-1.56 (1H, m), 1.43-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	497 (M+1)	

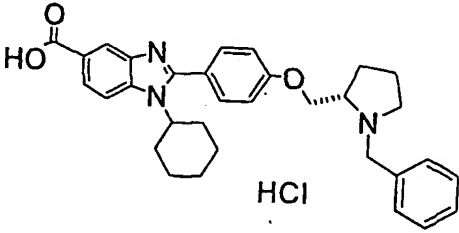
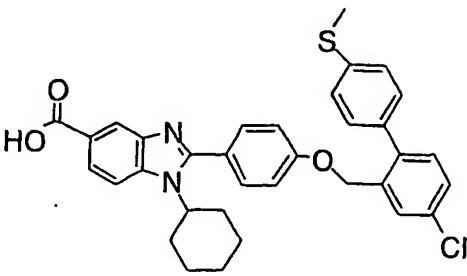
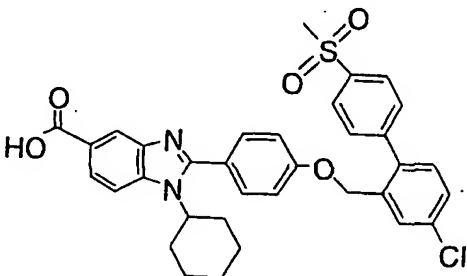
実施例番号	165	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 11.21 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.6Hz), 8.04 (1H, d, J=8.6Hz), 7.78 (2H, d, J=8.7Hz), 7.70-7.67 (2H, m), 7.55-7.42 (3H, m), 7.27 (2H, d, J=8.7Hz), 4.73-4.30 (5H, m), 4.20-3.97 (1H, m), 3.42-3.10 (2H, m), 2.45-1.23 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS		

表 46

実施例番号	166	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.27 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.4Hz), 7.97 (1H, d, J=9.0Hz), 7.73 (1H, d, J=1.8Hz), 7.68 (2H, d, J=8.4Hz), 7.54 (1H, d, J=8.4, 2.1Hz), 7.41-7.31 (5H, m), 7.19 (2H, d, J=8.4Hz), 5.10 (2H, s), 4.32 (1H, m), 2.50 (3H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.10 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	583 (M+1)	

実施例番号	167	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.25 (1H, s), 8.09 (1H, d, J=8.4Hz), 8.00 (2H, d, J=8.4Hz), 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80 (1H, d, J=2.1Hz), 7.73 (2H, d, J=8.1Hz), 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.60 (1H, dd, J=8.1, 2.1Hz), 7.44 (1H, d, J=8.1Hz), 7.16 (2H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.30 (1H, m), 3.26 (3H, s), 2.40-1.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	615 (M+1)	

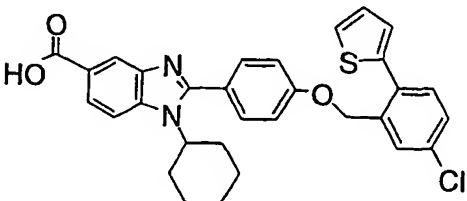
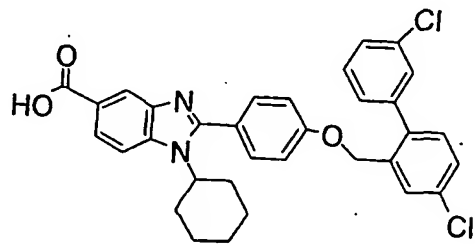
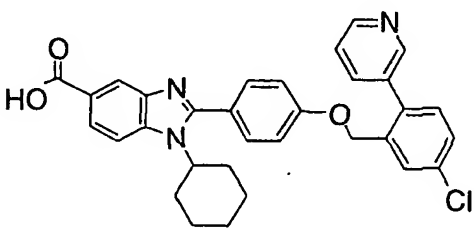
実施例番号	168	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 13.1 (1H, brs), 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8.8Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80-7.75 (3H, m), 7.69 (1H, d, J=4.1Hz), 7.57 (2H, m), 7.34-7.29 (3H, m), 7.20-7.15 (1H, m), 5.24 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.45-2.20 (2H, m), 2.20-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	543 (M+1)	



表 47

実施例番号	169	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.78-7.71 (3H, m), 7.59-7.41 (6H, m), 7.23 (2H, d, J=9.0 Hz), 5.11 (2H, s), 4.35 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	571 (M+1)	

実施例番号	170	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.7 (1H, brs), 8.66 (1H, s), 8.61 (1H, m), 8.21 (1H, s), 7.92-7.79 (4H, m), 7.61-7.56 (3H, m), 7.50-7.43 (2H, m), 7.10 (2H, d, J=8.7Hz), 5.09 (2H, s), 4.26 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	538 (M+1)	

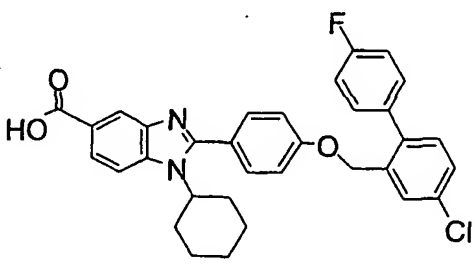
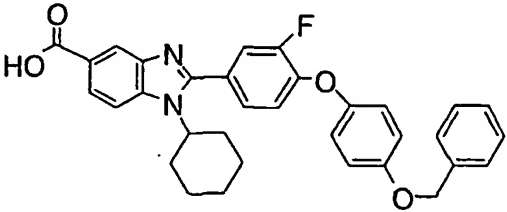
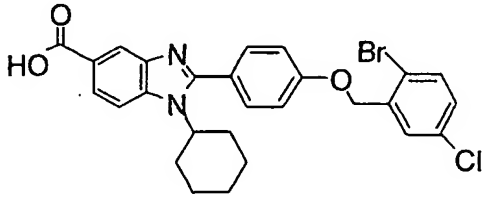
実施例番号	171	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.7Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.74-7.71 (3H, m), 7.57-7.46 (3H, m), 7.39 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.31-7.21 (4H, m), 5.11 (2H, s), 4.35 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	555 (M+1)	

表 48

実施例番号	172	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, d, J=10.5Hz), 7.70 (1H, dd, J=11.4, 1.8Hz), 7.48-7.32 (6H, m), 7.17-7.09 (5H, m), 5.12 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	537 (M+1)	

実施例番号	173	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.7Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.82-7.74 (4H, m), 7.45 (1H, dd, J=8.4, 3.0Hz), 7.39 (2H, d, J=8.7Hz), 5.28 (2H, s), 4.40 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	540 (M+1)	

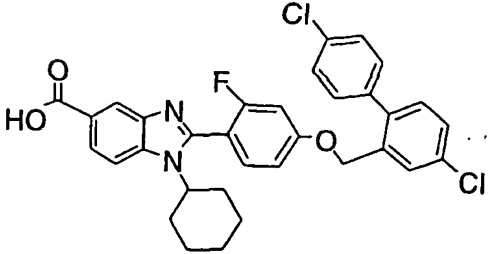
実施例番号	174	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.26 (1H, s), 8.01 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.80-7.70 (1H, m), 7.60-7.36 (7H, m), 7.18-6.91 (2H, m), 5.09 (2H, s), 4.11-3.90 (1H, m), 2.32-1.18 (14H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	590 (M+1)	

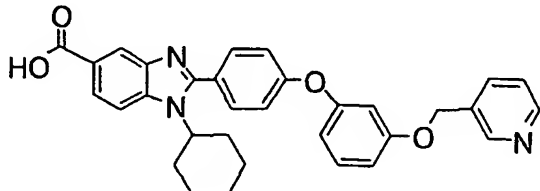
表 49

実施例番号	175	<sup>1</sup> H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.75 (1H, s), 8.21 (1H, s), 7.94 and 7.85 (2H, ABq, J=8.7 Hz), 7.61 and 7.00 (4H, A' B' q, J=8.5 Hz), 7.31-6.91 (2H, m), 7.25 (2H, d, J=7.7 Hz), 5.41 (2H, brs), 4.54 (2H, d, J=6.6 Hz), 4.35-4.14 (2H, m), 2.49-2.15 (3H, m), 1.95-1.55 (5H, m), 1.50-1.13 (5H, m), 1.10-0.77 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	568 (M+1)	

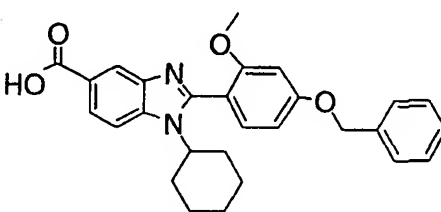
実施例番号	176	<sup>1</sup> H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.24 (1H, s), 7.97 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A' B' q, J=8.6Hz), 7.35 (1H, t, J=8.1Hz), 6.81 (1H, d, J=9.2Hz), 6.72 (1H, s), 6.71 (1H, d, J=6.5Hz), 4.48-4.20 (2H, m), 3.95-3.75 (3H, m), 3.03 (1H, t, J=12.3Hz), 2.60-2.40 (1H, m), 2.39-2.15 (2H, m), 2.07-1.58 (6H, m), 1.99 (3H, s), 1.50-1.00 (5H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	568 (M+1)	

実施例番号	177	<sup>1</sup> H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.76 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.20 (4H, A' B' q, J=8.6Hz), 7.39 (1H, t, J=8.2Hz), 6.86 (1H, d, J=8.3Hz), 6.81 (1H, s), 6.76 (1H, d, J=8.0Hz), 4.83 (2H, s), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	467 (M+1)	

表 50

実施例番号	178	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.85 (1H, s), 8.75 (1H, s), 8.63 (2H, d, J=3.8Hz), 8.25 (1H, s), 8.04-8.01 (2H, m), 8.02 and 7.90 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.72 and 7.20 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.57 (2H, dd, J=7.8, 5.0Hz), 7.40 (1H, t, J=8.2Hz), 6.93 (1H, d, J=8.2Hz), 6.87 (1H, s), 6.77 (1H, d, J=8.2Hz), 5.23 (2H, s), 4.33 (1H, br t, J=12.2Hz), 2.40-2.18 (2H, m), 2.00-1.55 (5H, m), 1.50-1.15 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	520 (M+1)	

実施例番号	179	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=9.0Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.58-7.32 (5H, m), 6.98 (1H, d, J=2.1Hz), 6.93 (1H, dd, J=8.7, 2.1Hz), 5.27 (2H, s), 4.16-4.00 (1H, m), 3.87 (3H, s), 2.20-2.12 (2H, m), 2.02-1.98 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.52-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	457 (M+1)	

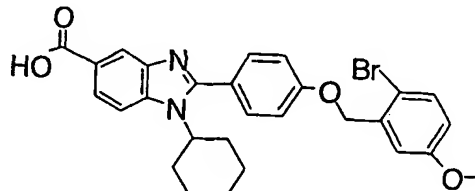
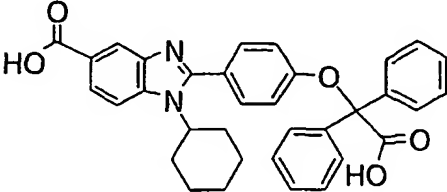
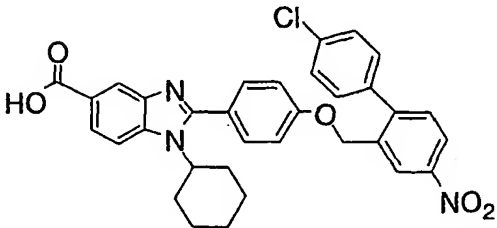
実施例番号	180	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.91 (1H, d, J=8.6Hz), 7.85 (1H, d, J=8.6Hz), 7.63 (2H, d, J=8.4Hz), 7.60 (1H, d, J=9.0Hz), 7.25 (2H, d, J=8.4Hz), 7.23 (1H, d, J=3.0Hz), 6.95 (1H, dd, J=9.0, 3.0Hz), 5.19 (2H, s), 4.30 (1H, m), 3.78 (3H, s), 2.40-2.19 (2H, m), 2.00-1.87 (4H, m), 1.66 (1H, m), 1.49-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	536 (M+1)	

表 51

実施例番号	181	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.19 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.65 (4H, d, J=7.4Hz), 7.47 (2H, d, J=8.7Hz), 7.44-7.27 (6H, m), 6.99 (2H, d, J=8.7Hz), 4.20 (1H, m), 2.34-2.12 (2H, m), 1.98-1.75 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.46-1.13 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	547 (M+)	

実施例番号	182	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.55 (1H, d, J=2.1Hz), 8.32 (1H, m), 8.21 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=7.8Hz), 7.68-7.56 (7H, m), 7.14 (2H, d, J=8.7Hz), 5.21 (1H, s), 4.26 (1H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.74-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	582 (M+)	

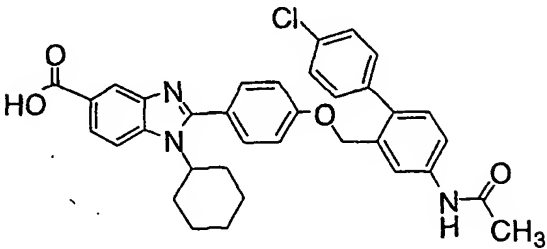
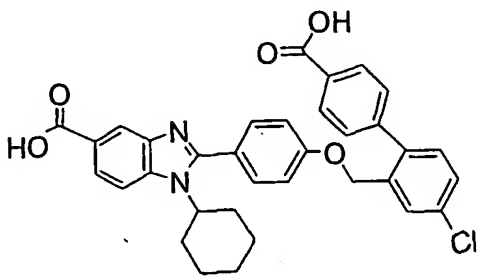
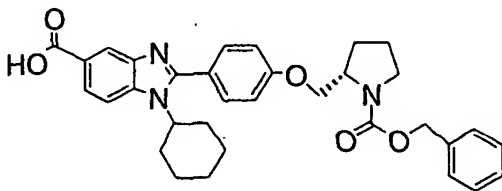
実施例番号	183	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.16 (1H, s), 8.25 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.7Hz), 7.94-7.87 (2H, m), 7.71-7.62 (3H, m), 7.50-7.42 (4H, m), 7.30 (1H, d, J=8.4Hz), 7.14 (2H, d, J=8.4Hz), 5.06 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.35-2.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	594 (M+)	

表 52

実施例番号	184	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 13.2 (2H, brs), 8.30 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.8Hz), 8.04 (1H, d, J=8.8Hz), 8.00 (2H, d, J=8.2Hz), 7.79 (1H, s), 7.73 (2H, d, J=8.7Hz), 7.61-7.56 (3H, m), 7.44 (1H, d, J=8.3Hz), 7.23 (2H, d, J=8.8Hz), 5.13 (2H, s), 4.35 (1H, m), 2.45-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (1H, m), 1.75-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	581 (M+1)	

実施例番号	185	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, m), 8.24 (1H, d, J=9.0Hz), 8.03 (1H, d, J=9.0Hz), 7.79-7.10 (9H, m), 5.20-5.07 (2H, m), 4.43-4.04 (4H, m), 3.50-3.36 (2H, m), 2.40-1.19 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	554 (M+1)	

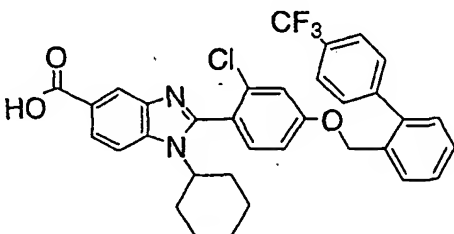
実施例番号	186	1H NMR (δ) ppm
		(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ : 8.29 (1H, brs), 8.10 (1H, d, J=8.4Hz), 7.97 (1H, d, J=8.4Hz), 7.79 (2H, d, J=8.4Hz), 7.74-7.67 (1H, m), 7.68 (2H, d, J=8.4Hz), 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.57-7.50 (2H, m), 7.46-7.39 (1H, m), 7.29 (1H, d, J=2.4Hz), 7.11 (1H, dd, J=2.4, 8.4Hz), 5.12 (2H, s), 3.99-3.84 (1H, m), 2.35-1.72 (6H, m), 1.68-1.55 (1H, m), 1.42-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	605 (M+1)	

表 53

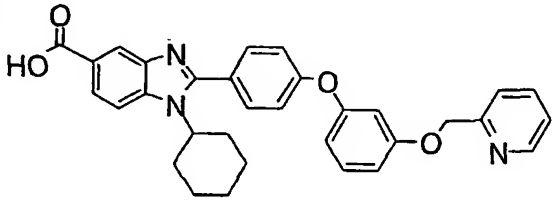
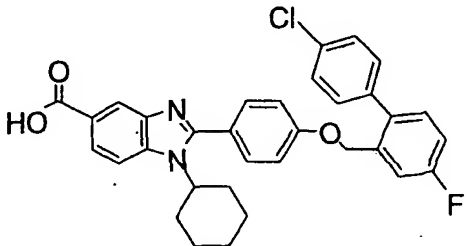
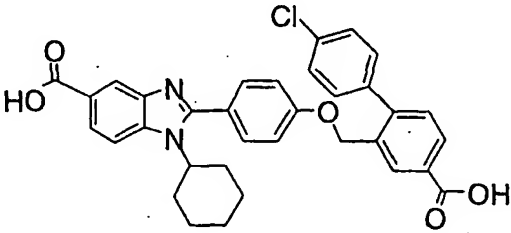
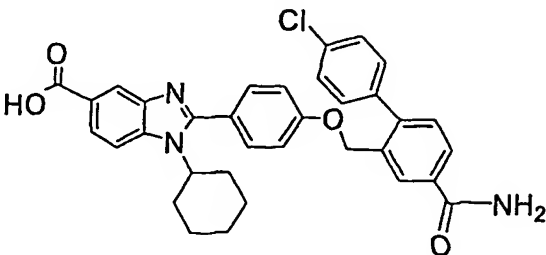
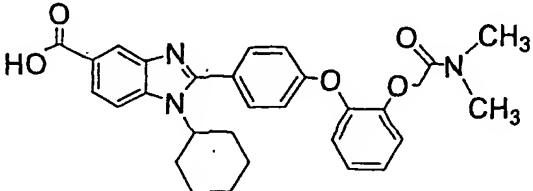
実施例番号	187	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.76 (1H, s), 8.57 (1H, d, J=4.4Hz), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, ABq, J=8.2Hz), 7.87-7.82 (1H, m), 7.68 and 7.12 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.53 (2H, d, J=7.8Hz), 7.37 (1H, t, J=8.3Hz), 7.36-7.33 (1H, m), 6.90 (1H, d, J=8.3Hz), 6.83 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.0Hz), 5.20 (2H, s), 4.31 (1H, br t, J=12.2Hz), 2.35-2.19 (2H, m), 1.99-1.57 (5H, m), 1.45-1.20 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	520 (M+1)	
実施例番号	188	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.77 (1H, brs), 8.21 (1H, d, J=1.4Hz), 7.92 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, dd, J=8.7, 1.4Hz), 7.57 (2H, d, J=8.7Hz), 7.57-7.27 (7H, m), 7.11 (2H, d, J=8.7Hz), 5.07 (2H, s), 4.26 (1H, m), 2.36-2.16 (2H, m), 1.98-1.75 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.49-1.17 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	555 (M+1)	
実施例番号	189	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.30-8.20 (2H, m), 8.10-7.98 (2H, m), 7.74 (2H, d, J=9.0Hz), 7.60-7.46 (5H, m), 7.24 (2H, d, J=9.0Hz), 5.19 (2H, s), 4.44-4.30 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.12-1.78 (4H, m), 1.72-1.58 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	581 (M+1)	

表 54

実施例番号	190	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.36-7.90 (5H, m), 7.74 (2H, d, J=8.6Hz), 7.60-7.40 (5H, m), 7.25 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.45-4.28 (1H, m), 2.40-2.15 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	580 (M+1)	

実施例番号	191	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.25-7.00 (6H, m), 4.86 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.89 (3H, s), 2.80 (3H, s), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	514 (M+1)	

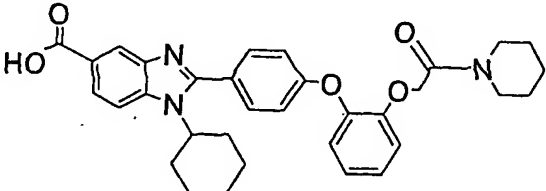
実施例番号	192	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.26-7.01 (6H, m), 4.84 (2H, s), 4.31 (1H, m), 3.36 (4H, m), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.15 (10H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	554 (M+1)	



表 55

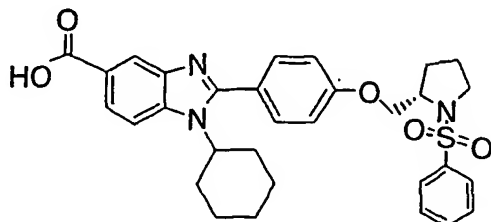
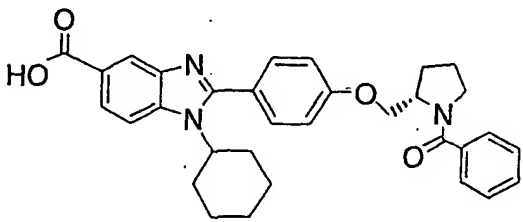
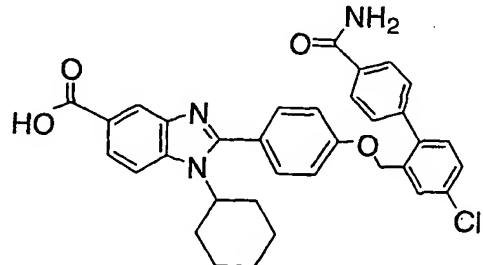
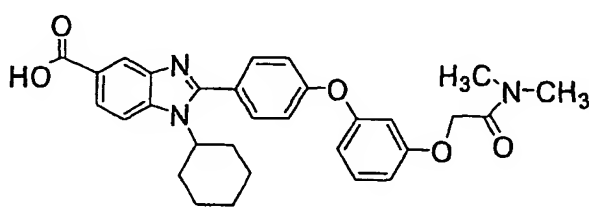
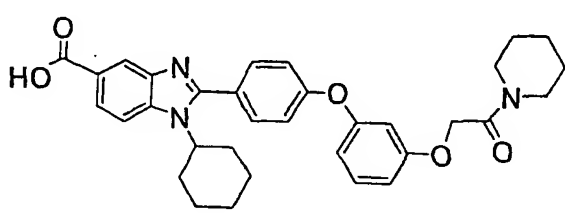
実施例番号	193	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.00 (1H, brs), 8.29 (1H, d, J=1.4Hz), 8.15 (1H, d, J=8.8Hz), 7.97 (1H, dd, J=1.4Hz, 8.8Hz), 7.89 (2H, d, J=8.8Hz), 7.80-7.60 (5H, m), 7.25 (2H, d, J=8.8Hz), 4.47-3.90 (4H, m), 3.20-3.10 (2H, m), 2.41-1.22 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	560 (M+1)	
実施例番号	194	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=8.5Hz), 7.87 (1H, d, J=8.5Hz), 7.70-7.17 (9H, m), 4.60-4.13 (4H, m), 3.72-3.40 (2H, m), 2.40-1.15 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	524 (M+1)	
実施例番号	195	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, s), 8.09-7.92 (5H, m), 7.77 (1H, s), 7.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.59-7.51 (3H, m), 7.43 (2H, d, J=8.4Hz), 7.17 (2H, d, J=8.7Hz), 5.10 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	580 (M+1)	

表 56

実施例番号	196	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=8.4Hz), 7.69 and 7.18 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.34 (1H, t, J=8.0Hz), 6.80-6.69 (3H, m), 4.83 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.98 (3H, s), 2.84 (3H, s), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	514 (M+1)	

実施例番号	197	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 and 7.18 (4H, ABq, J=8.7Hz), 7.35 (1H, t, J=8.4Hz), 6.80-6.70 (3H, m), 4.82 (2H, s), 4.31 (1H, m), 3.40 (4H, m), 2.29 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.15 (10H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	554 (M+1)	

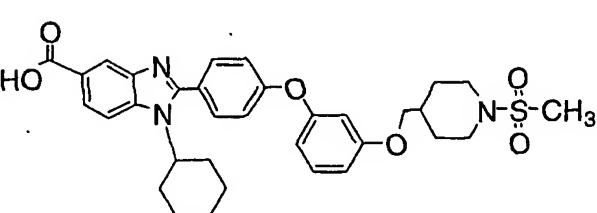
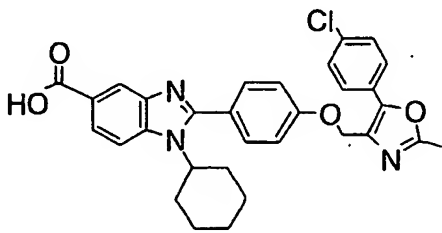
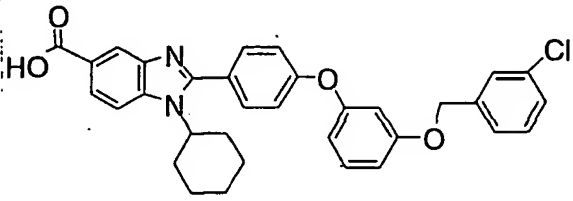
実施例番号	198	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=4.4Hz), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.36 (1H, t, J=7.8Hz), 6.82 (1H, d, J=9.3Hz), 6.73 (1H, s), 6.71 (1H, d, J=7.2Hz), 4.30 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.89 (2H, d, J=6.0Hz), 3.59 (2H, d, J=11.7Hz), 2.85 (3H, s), 2.73 (2H, t, J=10.5Hz), 2.41-2.20 (2H, m), 1.98-1.59 (8H, m), 1.46-1.18 (5H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	604 (M+1)	

表 57

実施例番号	199	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.30 (1H, d, J=8.9Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.70 (2H, d, J=8.7Hz), 7.61 (2H, d, J=8.7Hz), 7.39 (2H, d, J=8.8Hz), 5.28 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.50-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	542 (M+1)	

実施例番号	200	1H NMR (δ) ppm
		(DMSO-d6) δ : 8.23 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.69 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52 (1H, s), 7.50-7.30 (4H, m), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.90 (1H, d, J=8.3Hz), 6.84 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.3Hz), 5.15 (2H, s), 4.39-4.21 (1H, m), 2.39-2.18 (2H, m), 1.99-1.80 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	553 (M+1)	

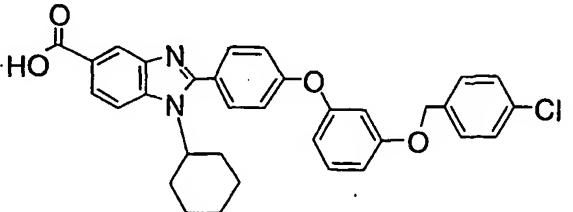
実施例番号	201	1H NMR (δ) ppm
		(DMSO-d6) δ : 8.26 (1H, s), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.92 (1H, d, J=8.7Hz), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.47 (4H, s), 7.38 (1H, t, J=8.2Hz), 7.20 (2H, d, J=8.7Hz), 6.90 (1H, d, J=8.2Hz), 6.83 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.2Hz), 5.14 (2H, s), 2.40-2.19 (2H, m), 2.04-1.78 (4H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	553 (M+1)	

表 58

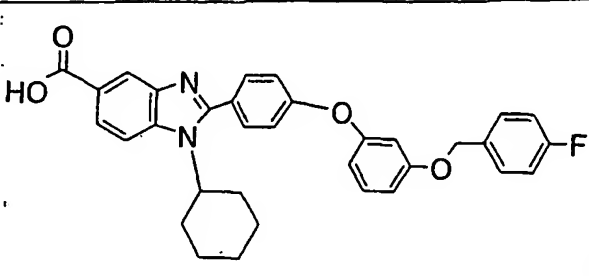
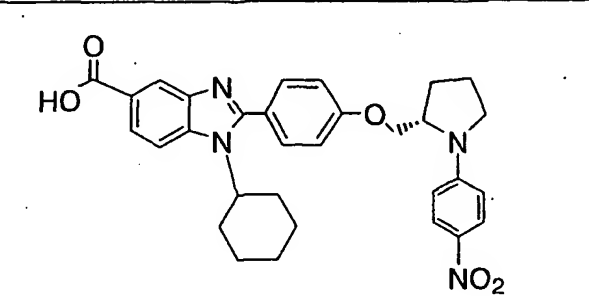
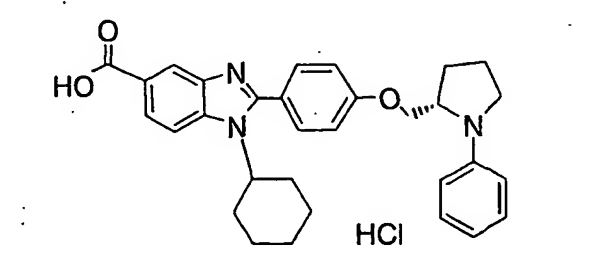
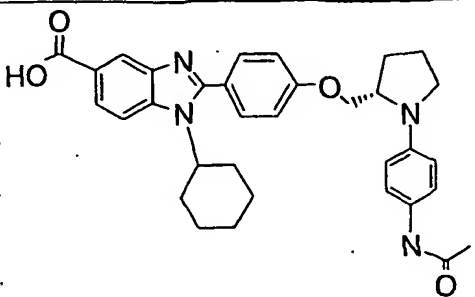
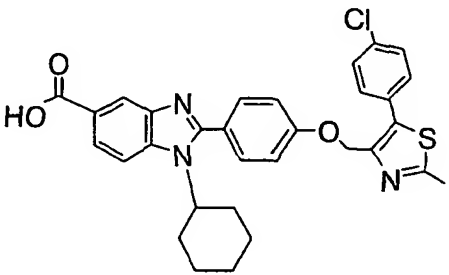
実施例番号	202	1H NMR (δ) ppm
		(DMSO-d6) δ : 12.81 (1H, brs), 8.24 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.69 (2H, d, J=8.6Hz), 7.53-7.47 (2H, m), 7.38 (1H, t, J=8.2Hz), 7.26-7.16 (4H, m), 6.89 (1H, d, J=8.2Hz), 6.82 (1H, s), 6.73 (1H, d, J=8.2Hz), 5.11 (2H, s), 4.40-4.21 (1H, m), 2.40-2.17 (2H, m), 2.01-1.77 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	537 (M+1)	
実施例番号	203	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.74 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 8.08 (2H, d, J=9.0Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (2H, d, J=8.7Hz), 7.58 (2H, d, J=8.7Hz), 7.13 (2H, d, J=8.7Hz), 6.83 (2H, d, J=9.0Hz), 4.50-4.08 (4H, m), 3.68-3.30 (2H, m), 2.40-1.23 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	541 (M+1)	
実施例番号	204	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.39-8.28 (2H, m), 8.08 (1H, d, J=8.8Hz), 7.76 (2H, d, J=8.7Hz), 7.29 (2H, d, J=8.7Hz), 7.25-7.13 (2H, m), 6.80-6.60 (3H, m), 4.46-3.98 (4H, m), 3.51-3.42 (1H, m), 3.20-3.04 (1H, m), 2.39-1.20 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS		

表 59

実施例番号	205	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.59 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.4Hz), 7.90 ( 1H, d, J=8.4Hz), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz), 7.39 (2H, 2H, d, J= 8.7Hz) 7.18 (2H, d, J=8.7Hz) , 6.63 (2H, d, J=8.7Hz), 3.95 -3.37 (4H, m), 3.51-3.40 (1H , m), 3.17-3.02 (1H, m), 2.39 -1.18 (17H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	553 (M+1)	

実施例番号	206	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.1 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.8Hz), 8.06 ( 1H, d, J=8.7Hz), 7.77 (2H, d, J=8.7Hz), 7.59-7.52 (4H, m) , 7.35 (2H, d, J=8.8Hz), 5.19 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.71 (3 H, s), 2.45-2.20 (2H, m), 2.2 0-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2 H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.5 5-1.15 (3H, m).
純度	> 90 % (NMR)	
MS	558 (M+1)	

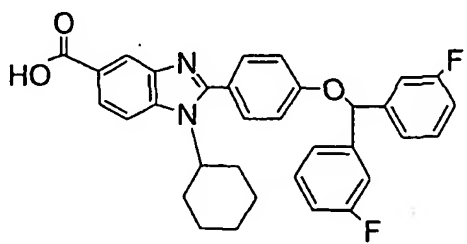
実施例番号	207	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8 .8Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz) , 7.73 (2H, d, J=8.8Hz), 7.50 -7.41 (6H, m), 7.36 (2H, d, J= 8.8Hz), 7.18-7.13 (2H, m), 6 .84 (1H, s), 4.33 (1H, m), 2.4 0-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2 H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.7 5-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3 H, m).
純度	> 90 % (NMR)	
MS	539 (M+1)	

表 60

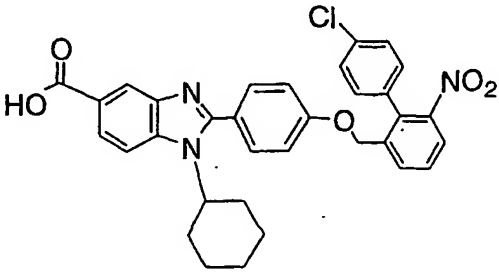
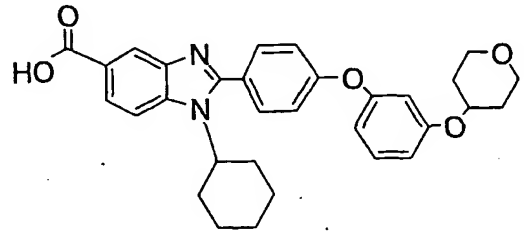
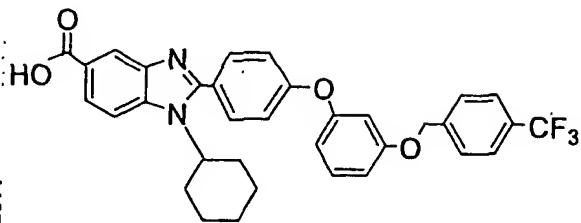
実施例番号	208	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.07-8.00 (3H, m), 7.79-7.70 (3H, m), 7.51 (2H, d, J=8.1Hz), 7.40 (2H, d, J=8.4Hz), 7.18 (2H, d, J=8.7Hz), 4.99 (2H, s), 4.34 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	582 (M+1)	
実施例番号	209	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, d, J=4.4Hz), 7.98 and 7.88 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.70 and 7.19 (4H, A' B' q, J=8.4Hz), 7.35 (1H, t, J=8.4Hz), 6.86 (1H, d, J=8.1Hz), 6.79 (1H, s), 6.71 (1H, d, J=8.1Hz), 4.65-4.53 (1H, m), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.88-3.78 (2H, m), 3.48 (2H, t, J=9.0Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 1.02-1.71 (6H, m), 1.70-1.50 (3H, m), 1.46-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	513 (M+1)	
実施例番号	210	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.87 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.84-7.66 (6H, m), 7.38 (1H, t, J=8.4Hz), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.91 (1H, d, J=9.0Hz), 6.84 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.1Hz), 5.26 (2H, s), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 1.99-1.76 (4H, m), 1.69-1.58 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	587 (M+1)	

表 61

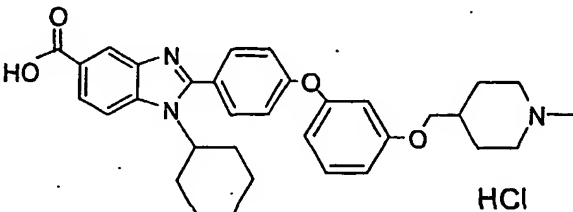
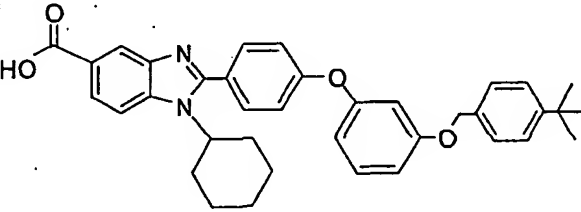
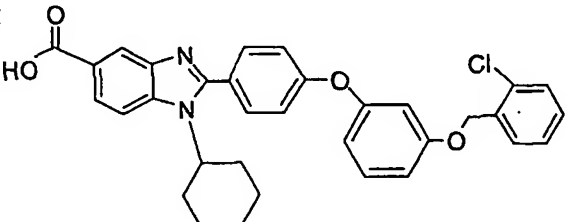
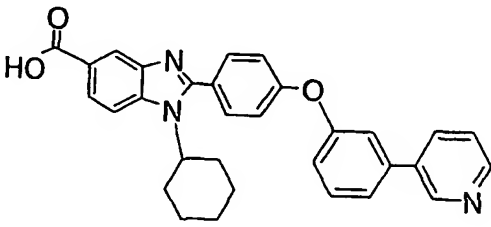
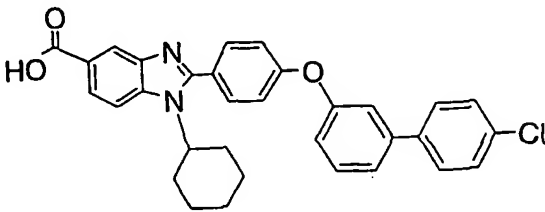
実施例番号	211	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.15 and 7.47 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.77 and 7.24 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.39 (1H, t, J=7.8Hz), 6.84 (1H, d, J=9.3Hz), 6.76 (1H, s), 6.75 (1H, d, J=9.5Hz), 4.36 (1H, brt, J=12.2Hz), 3.89 (2H, d, J=6.0Hz), 3.42 (2H, d, J=10.8Hz), 3.04-2.88 (2H, m), 2.78-2.60 (1H, m), 2.71 (2H, d, J=4.8Hz), 2.38-2.20 (2H, m), 2.07-1.80 (7H, m), 1.70-1.20 (5H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	540 (M+1)	
実施例番号	212	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.22 (1H, s), 7.93 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.68 and 7.17 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.43-7.33 (5H, m), 6.87 (1H, d, J=8.1Hz), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 6.91 (1H, d, J=9.0Hz), 6.81 (1H, s), 6.72 (1H, d, J=8.0Hz), 5.08 (2H, s), 4.36 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.37-2.20 (2H, m), 1.98-1.78 (4H, m), 1.69-1.60 (1H, m), 1.41-1.21 (3H, m), 1.28 (9H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	575 (M+1)	
実施例番号	213	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.23 (1H, s), 7.95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.4Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.62-7.36 (5H, m), 6.90 (1H, d, J=8.1Hz), 6.84 (1H, s), 6.76 (1H, d, J=8.1Hz), 5.19 (2H, s), 4.31 (1H, brt, J=12.2Hz), 2.40-2.19 (2H, m), 1.99-1.76 (4H, m), 1.68-1.55 (1H, m), 1.50-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	553 (M+1)	

表 62

実施例番号	214	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.94 (1H, d, J=2.1Hz), 8.60 (1H, dd, J=4.8, 1.5Hz), 8.23 (1H, d, J=1.5Hz), 8.12 (1H, dt, J=8.1, 2.1Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.70 (1H, d, J=8.7Hz), 7.67-7.54 (3H, m), 7.50 (1H, dd, J=8.1, 4.8Hz), 7.25 (2H, d, J=8.7Hz), 7.21 (1H, m), 4.31 (1H, m), 2.38-2.19 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.48-1.22 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	490 (M+1)	

実施例番号	215	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.75 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.73 (2H, d, J=8.4Hz), 7.71 (2H, d, J=8.4Hz), 7.63-7.39 (2H, m), 7.52 (2H, d, J=8.4Hz), 7.24 (2H, d, J=8.4Hz), 7.18 (1H, m), 4.31 (1H, m), 2.39-2.20 (2H, m), 2.00-1.76 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.49-1.18 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	523 (M+1)	

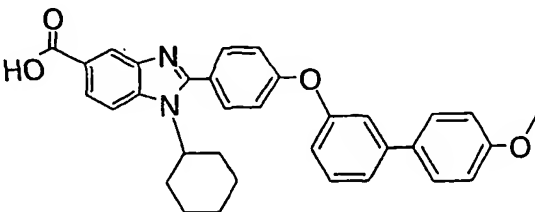
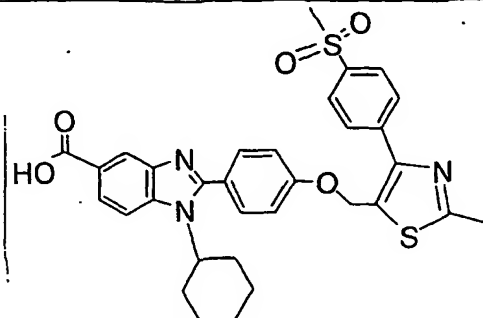
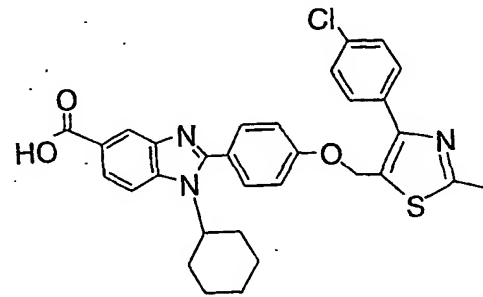
実施例番号	216	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.77 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=1.4Hz), 7.95 (1H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, dd, J=8.6, 1.4Hz), 7.70 (2H, d, J=8.7Hz), 7.64 (2H, d, J=8.8Hz), 7.56-7.48 (2H, m), 7.40 (1H, s), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 7.10 (1H, m), 7.03 (2H, d, J=8.8Hz), 4.31 (1H, m), 3.80 (3H, s), 2.48-2.20 (2H, m), 2.00-1.88 (4H, m), 1.66 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	519 (M+1)	



表 63

実施例番号	217	1H NMR (δ) ppm
		(DMSO-d6) δ : 12.80 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.6Hz), 7.96 (3H, d, J=8.6Hz), 7.86 (1H, d, J=8.7Hz), 7.63 (2H, d, J=8.6Hz), 7.25 (2H, d, J=8.6Hz), 5.50 (2H, s), 4.36-4.21 (1H, m), 3.27 (3H, s), 2.74 (3H, s), 2.40-2.19 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.49-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	602 (M+1)	

実施例番号	218	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.9 (1H, brs), 8.25 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.91 (1H, d, J=8.6Hz), 7.72 (2H, d, J=8.5Hz), 7.67 (2H, d, J=8.7Hz), 7.56 (2H, d, J=8.5Hz), 7.26 (2H, d, J=8.7Hz), 5.45 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.71 (3H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	558 (M+1)	

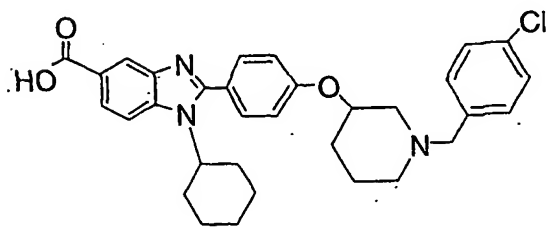
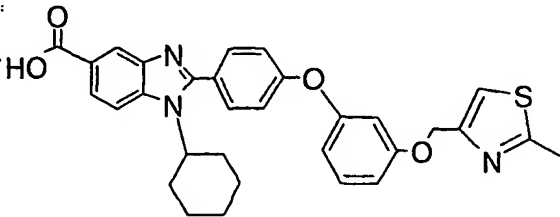
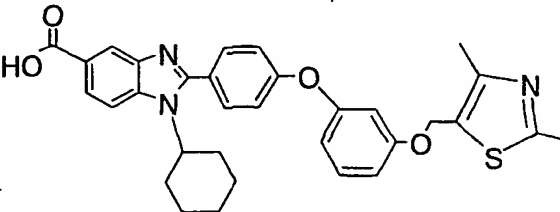
実施例番号	219	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, d, J=1.5Hz), 7.93 (1H, d, J=9.0Hz), 7.84 (1H, dd, J=9.0, 1.5Hz), 7.56 (2H, d, J=8.7Hz), 7.42-7.30 (4H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 4.53 (1H, brs), 4.36-4.20 (1H, m), 3.55 (2H, brs), 3.00-2.90 (1H, m), 2.70-2.58 (1H, m), 2.40-1.10 (18H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	544 (M+1)	

表 64

実施例番号	220	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.76 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.87 (2H, ABq, J=8.9 Hz), 7.69 and 7.19 (4H, A' B' q, J=8.6 Hz), 7.55 (1H, s), 7.37 (1H, t, J=8.1 Hz), 6.91 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.85 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=7.5 Hz), 5.13 (2H, s), 4.31 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.65 (3H, s), 2.41-2.20 (2H, m), 2.00-1.74 (4H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.58-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	540 (M+1)	

実施例番号	221	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6 Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A' B' q, J=8.7 Hz), 7.37 (1H, t, J=8.2 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.2 Hz), 6.82 (1H, s), 6.75 (1H, d, J=8.0 Hz), 5.24 (2H, s), 4.32 (1H, brt, J=12.2 Hz), 2.58 (3H, s), 2.38-2.20 (2H, m), 2.30 (3H, s), 2.00-1.79 (4H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.44-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	554 (M+1)	

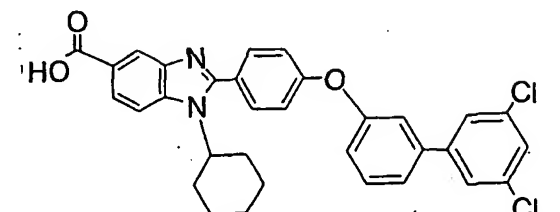
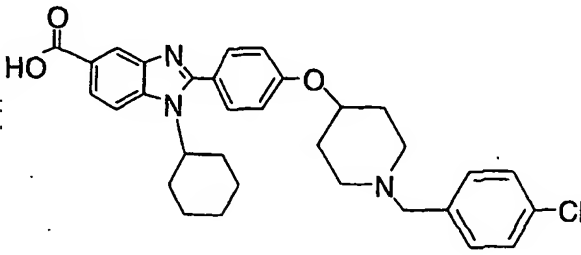
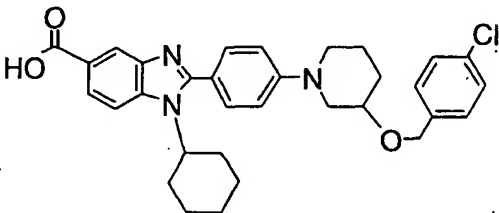
実施例番号	222	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.88 (1H, brs), 8.25 (s, 1H), 8.07-7.57 (11H, m), 7.26 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.24 (1H, m), 4.34 (1H, m), 2.30-2.20 (2H, m), 2.03-1.78 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.49-1.19 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	557 (M+1)	

表 65

実施例番号	223	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.96 (1H, brs), 8.21 (1H, d, J=1.4Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.84 (1H, dd, J=8.7, 1.4 Hz), 7.76-7.40 (7H, m), 7.18 (2H, d, J=8.0Hz), 4.24-4.16 (2H, m), 2.40-1.12 (18H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	544 (M+1)	

実施例番号	224	1H NMR (δ) ppm
		(DMSO-d6) δ : 8.22 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.4Hz), 7.92 (1H, d, J=8.4Hz), 7.54 (2H, d, J=8.7Hz), 7.40 (2H, d, J=8.4Hz), 7.30 (2H, d, J=8.4Hz), 7.14 (2H, d, J=8.7Hz), 4.61 (2H, s), 4.48-4.32 (1H, m), 3.82 (1H, brd, J=12.3Hz), 3.65-3.47 (2H, m), 3.10 (brdd, J=8.4, 12.3Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2.09-1.76 (6H, m), 1.71-1.16 (6H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	544 (M+1)	

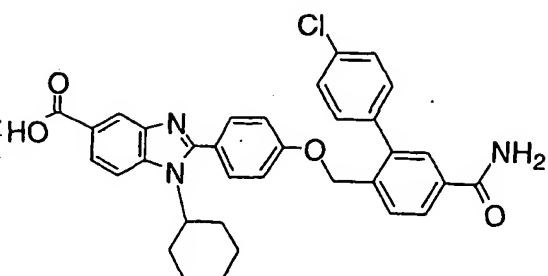
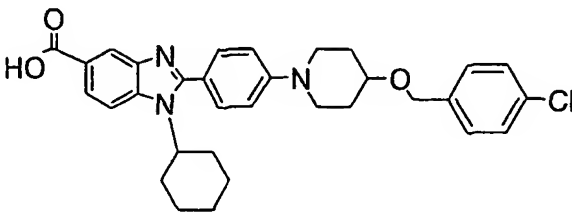
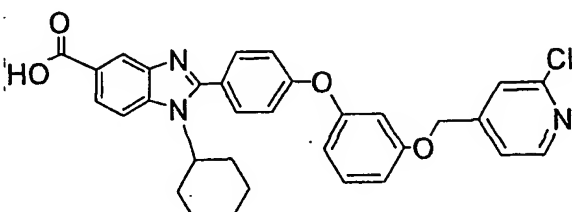
実施例番号	225	1H NMR (δ) ppm
		(DMSO-d6) δ : 12.83 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 8.10 (1H, brs), 7.01-7.91 (2H, m), 7.89-7.82 (2H, m), 7.75 (1H, d, J=8.0Hz), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.53 (4H, s), 7.46 (1H, brs), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 7.23 (2H, s), 4.35-4.17 (1H, m), 2.38-2.20 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.48-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	580 (M+1)	

表 66

実施例番号	226	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 and 8.08 (2H, ABq, J=8.7 Hz), 8.31 (1H, m), 7.66 and 7.26 (4H, A'B'q, J=9.2 Hz), 7.42 and 7.39 (4H, A''B''q, J=8.7 Hz), 4.57 (2H, s), 4.50 (1H, br t, J=12.2 Hz), 3.85-3.62 (3H, m), 3.28-3.16 (2H, m), 2.42-2.23 (2H, m), 2.14-1.81 (6H, m), 1.72-1.25 (6H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	544 (M+1)	

実施例番号	227	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.43 (1H, d, J=5.0 Hz), 8.23 (1H, s), 7.96 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6 Hz), 7.69 and 7.18 (4H, A'B'q, J=8.6 Hz), 7.57 (1H, s), 7.47 (1H, d, J=5.0 Hz), 7.40 (2H, t, J=8.2 Hz), 6.91 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.85 (1H, s), 6.77 (1H, d, J=7.9 Hz), 5.25 (2H, s), 4.31 (1H, br t, J=12.2 Hz), 2.40-2.19 (2H, m), 1.99-1.75 (4H, m), 1.73-1.57 (1H, m), 1.49-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	554 (M+1)	

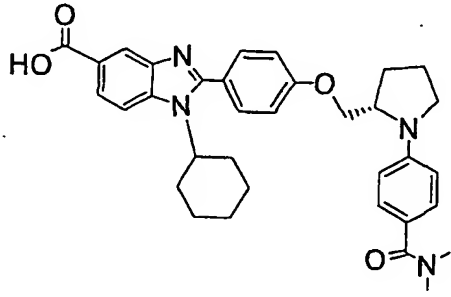
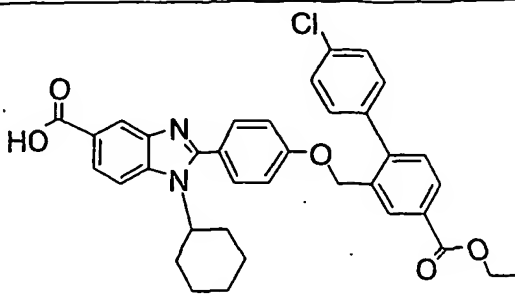
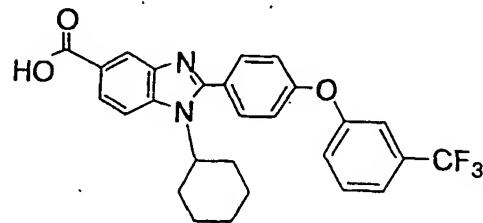
実施例番号	228	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.87 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.60 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.32 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.17 (2H, d, J=8.7 Hz), 6.70 (2H, d, J=8.7 Hz), 4.35-3.97 (4H, m), 3.62-3.11 (2H, m), 2.96 (6H, s), 2.39-1.12 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	567 (M+1)	

表 67

実施例番号	229	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.04 (1H, dd, J=8.1, 1.8Hz), 7.92 (1H, d, J=8.1Hz), 7.84 (1H, d, J=9.9Hz), 7.62-7.50 (7H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.36 (2H, q, J=6.9Hz), 4.30-4.20 (1H, m), 2.38-2.18 (2H, m), 1.98-1.18 (8H, m), 1.35 (3H, t, J=6.9Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	608 (M+1)	

実施例番号	230	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.35 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=9.0Hz), 7.87 (2H, d, J=8.7Hz), 7.74 (1H, t, J=8.1Hz), 7.64 (1H, d, J=7.8Hz), 7.59-7.50 (2H, m), 7.36 (2H, d, J=8.7Hz), 4.39 (1H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.20 (3H, m).
純度	約90% (NMR)	
MS	481 (M+1)	

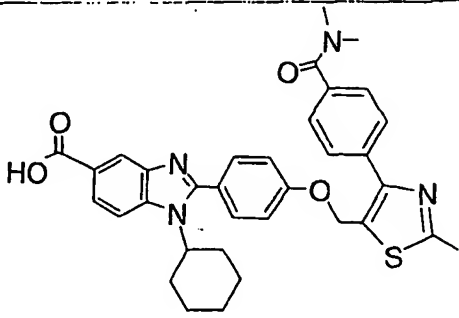
実施例番号	231	1H NMR (δ) ppm
		300MHz DMSO-d6 12.78 (1H, brs), 8.23 (1H, d, J=1.5Hz), 7.96 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.75 (2H, d, J=8.4Hz), 7.63 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52 (2H, d, J=8.4Hz), 7.24 (2H, d, J=8.4Hz), 5.47 (2H, s), 4.29 (1H, m), 2.97 (6H, brs), 2.72 (3H, s), 2.39-2.16 (2H, m), 2.00-1.78 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.49-1.17 (3H, m).
純度	約90% (NMR)	
MS	595 (M+1)	

表 68

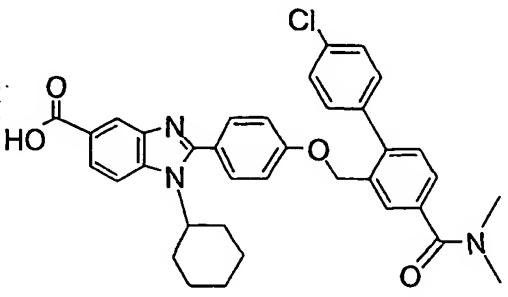
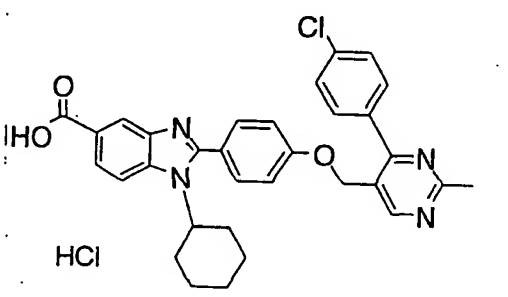
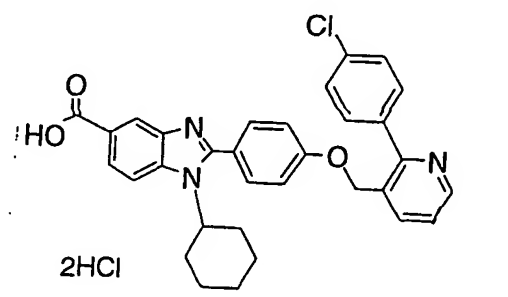
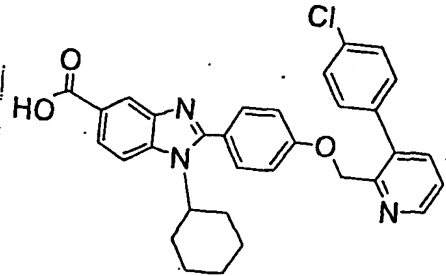
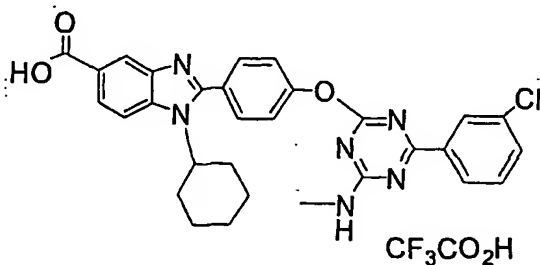
実施例番号	232	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.8 (1H, brs), 8.22 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.7Hz), 7.86 (1H, d, J=8.6Hz), 7.70 (1H, s), 7.59 (2H, d, J=8.7Hz), 7.53-7.50 (5H, m), 7.42 (1H, d, J=7.9Hz), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.27 (1H, m), 3.01 (3H, brs), 2.97 (3H, brs), 2.40-2.15 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	608 (M+1)	
実施例番号	233	1H NMR (δ) ppm
		DMSO-d6 13.20 (1H, brs), 8.99 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.8Hz), 8.04 (1H, d, J=8.6Hz), 7.79-7.74 (4H, m), 7.60 (2H, d, J=8.5Hz), 7.30 (2H, d, J=8.7Hz), 5.26 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.72 (3H, s), 2.50-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	553 (M+1-HCl)	
実施例番号	234	1H NMR (δ) ppm
		DMSO-d6 8.77 (1H, d, J=3.6Hz), 8.36-8.26 (3H, m), 8.08 (1H, d, J=8.8Hz), 7.79 (2H, d, J=8.7Hz), 7.72-7.64 (3H, m), 7.58 (2H, d, J=8.4Hz), 7.30 (2H, d, J=8.7Hz), 5.26 (2H, s), 4.38 (1H, m), 2.50-2.15 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m).
純度	> 90% (NMR)	
MS	538 (M+1-2HCl)	

表 69

実施例番号	235	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.74 (1H, brs), 8.67 (1H, dd, J=3.1, 1.6Hz), 8.21 (1H, d, J=1.6Hz), 7.93 (1H, d, J=8.6Hz), 7.90-7.80 (2H, m), 7.60-7.50 (7H, m), 7.09 (2H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.26 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.00-1.60 (5H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	APCI-MS 538 (M+1)	

実施例番号	236	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.40-7.40 (11H, m), 2.95, 2.81 (3H, each d, J=4.7Hz), 2.40-2.20 (2H, m), 2.10-1.80 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	APCI-MS 555 (M+1)	

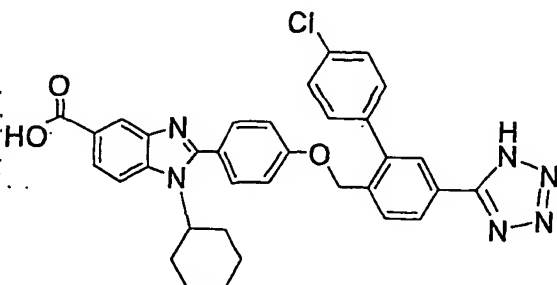
実施例番号	237	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=9.5Hz), 8.02 (1H, s), 8.00-7.80 (3H, m), 7.70-7.50 (6H, m), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.28 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.65 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	FAB-MS 605 (M+1)	

表 70

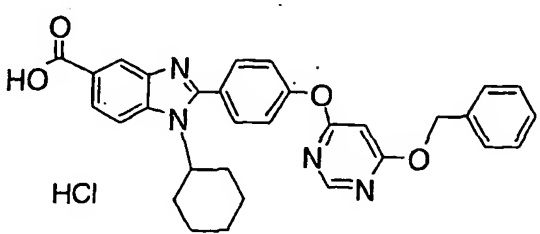
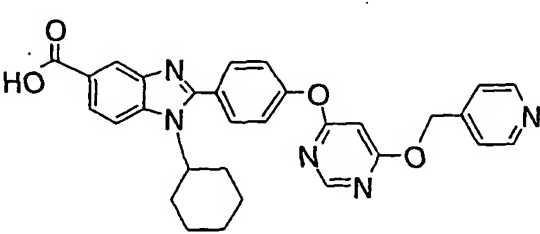
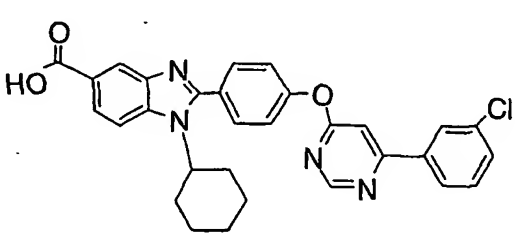
実施例番号	238	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.54 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.98 and 7.88 (2H, Abq, J=8.6Hz), 7.76 (2H, d, J=8.6Hz), 7.53-7.31 (3H, m), 6.61 (1H, s), 5.46 (2H, s), 4.32 (1H, brt), 2.40-2.20 (2H, m), 2.02-1.79 (4H, m), 1.69-1.59 (1H, m), 1.48-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	APCI-MS 521 (M+1)	
実施例番号	239	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.79 (1H, brs), 8.60 (2H, d, J=1.5Hz), 8.53 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.98 and 7.85 (2H, ABq, J=9.4Hz), 7.76 (2H, d, J=9.0Hz), 7.44 (4H, d, J=6.5Hz), 6.69 (1H, s), 5.53 (2H, s), 4.32 (1H, brt), 2.40-2.19 (2H, m), 2.03-1.82 (4H, m), 1.72-1.61 (1H, m), 1.42-1.22 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	APCI-MS 522 (M+1)	
実施例番号	240	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.90 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.28 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.3Hz), 8.05 (1H, d, J=8.8Hz), 7.96 (1H, s), 7.93 (1H, d, J=8.8Hz), 7.83 (1H, d, J=8.4Hz), 7.68-7.59 (2H, m), 7.54 (2H, d, J=8.8Hz), 4.37 (1H, brt), 2.30 (2H, m), 2.00 (2H, m), 1.88 (2H, m), 1.67 (1H, m), 1.5-1.2 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	APCI-MS 525 (M+1)	



表71

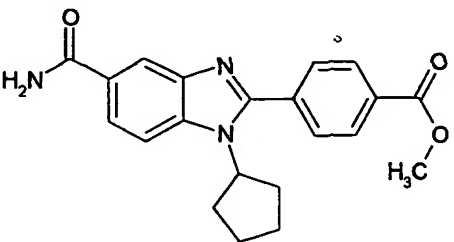
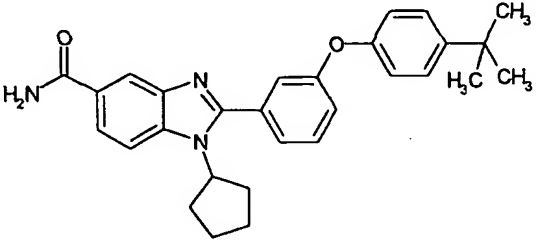
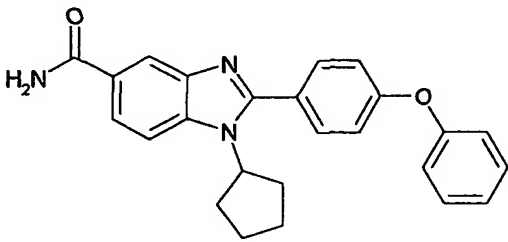
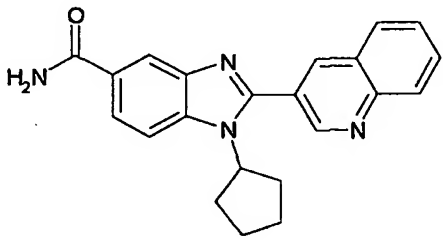
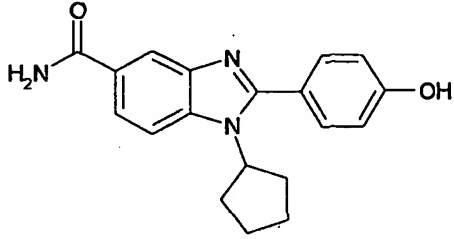
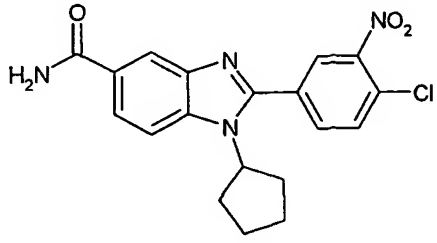
実施例 番号	式	MS
1001		364(M+H)
1002		454(M+H)
1003		398(M+H)
1004		357(M+H)
1005		322(M+H)
1006		385(M+H)

表72

実施例 番号	式	MS
1007		357(M+H)
1008		416(M+H)
1009		310(M+H)
1010		390(M+H)
1011		395(M+H)
1012		366(M+H)

表73

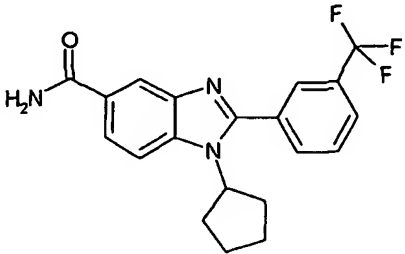
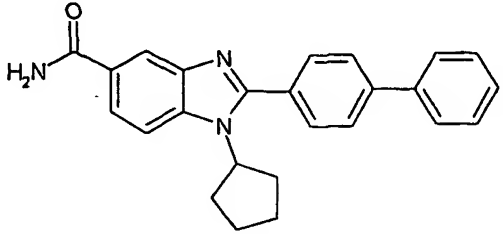
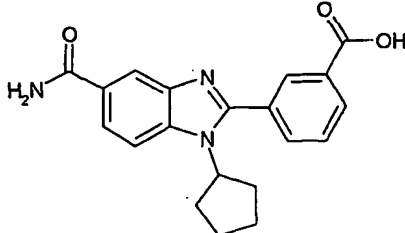
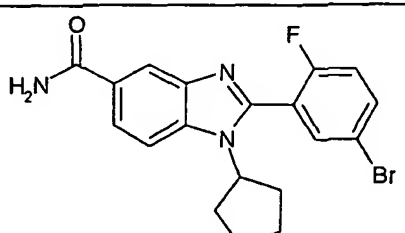
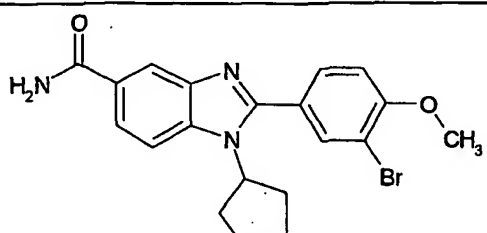
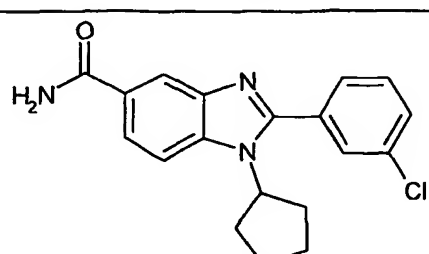
実施例 番号	式	MS
1013		374(M+H)
1014		382(M+H)
1015		350(M+H)
1016		402(M+H)
1017		414(M+H)
1018		340(M+H)

表74

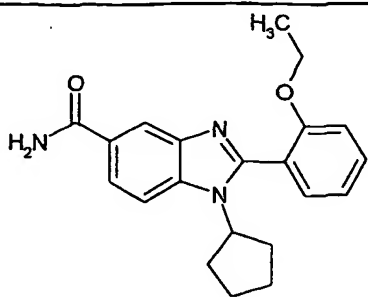
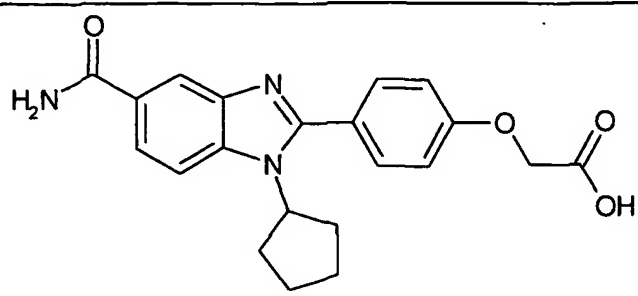
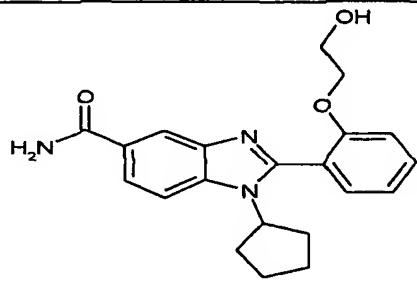
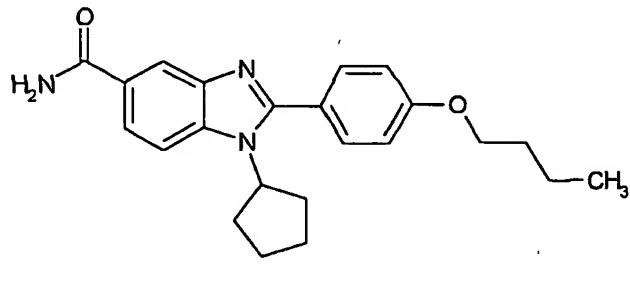
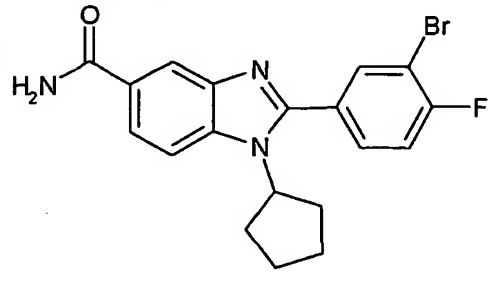
实施例 番号	式	MS
1019		350(M+H)
1020		380(M+H)
1021		366(M+H)
1022		378(M+H)
1023		402(M+H)

表75

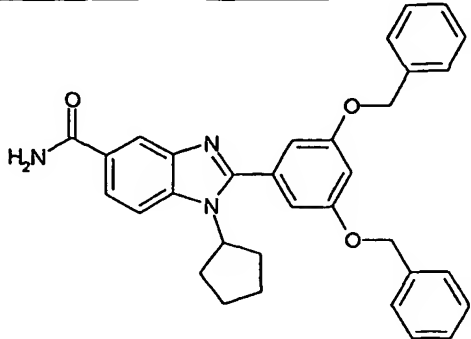
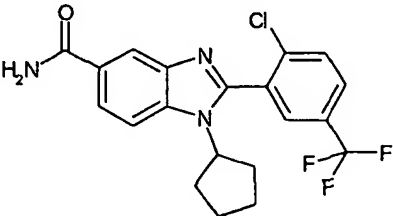
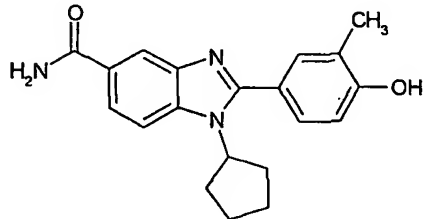
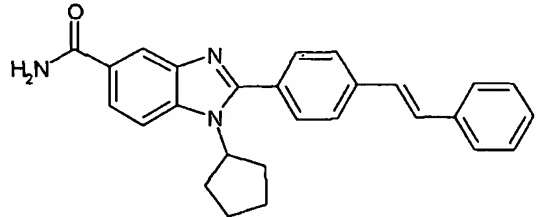
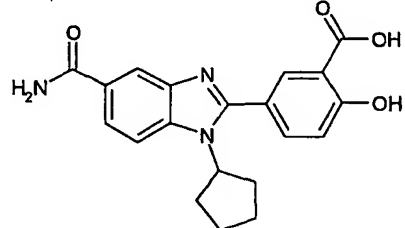
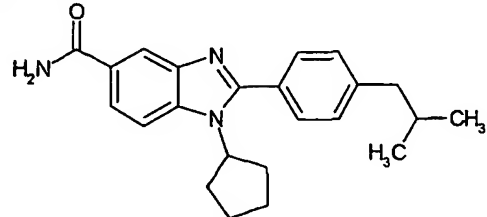
実施例 番号	式	MS
1024		518(M+H)
1025		408(M+H)
1026		336(M+H)
1027		408(M+H)
1028		366(M+H)
1029		362(M+H)

表76

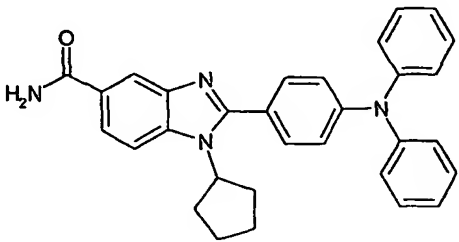
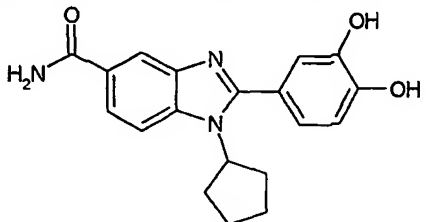
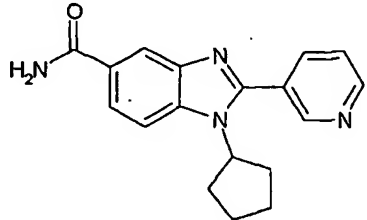
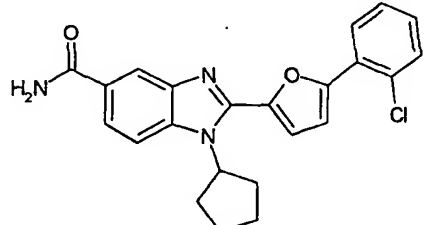
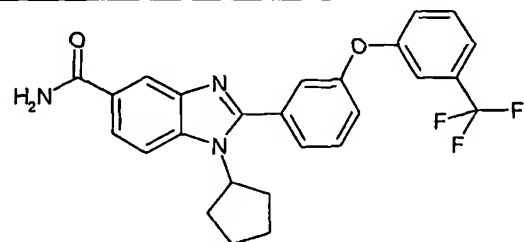
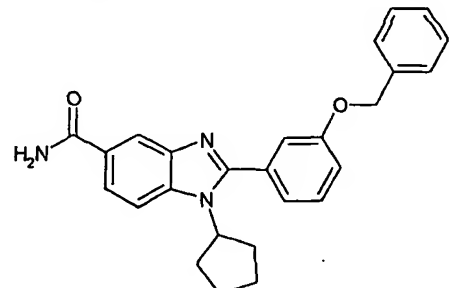
実施例 番号	式	MS
1030		473(M+H)
1031		338(M+H)
1032		307(M+H)
1033		406(M+H)
1034		466(M+H)
1035		412(M+H)

表77

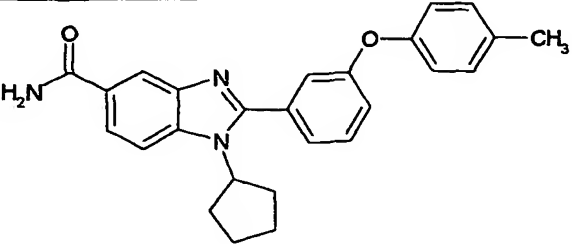
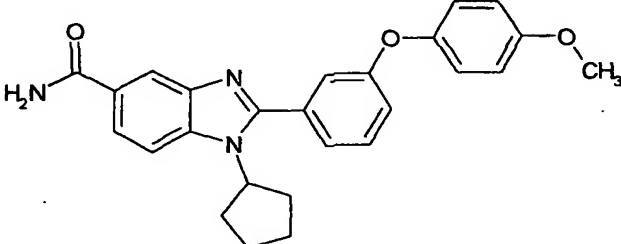
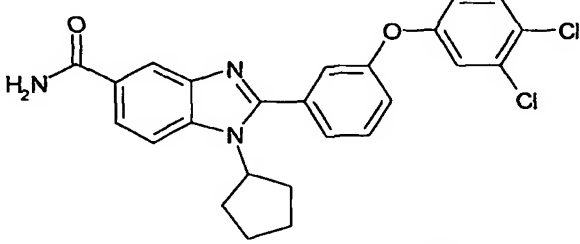
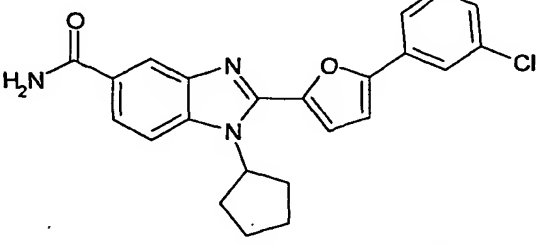
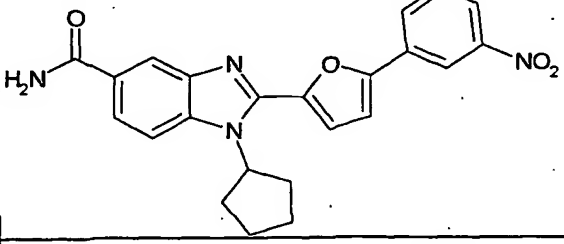
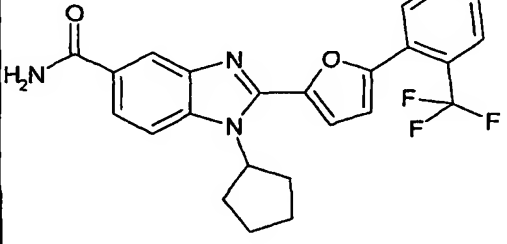
実施例 番号	式	MS
1036		412(M+H)
1037		428(M+H)
1038		466(M+H)
1039		406(M+H)
1040		417(M+H)
1041		440(M+H)

表78

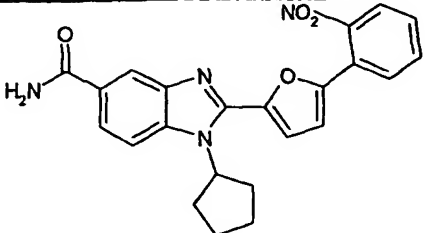
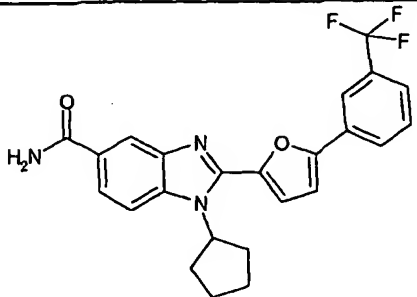
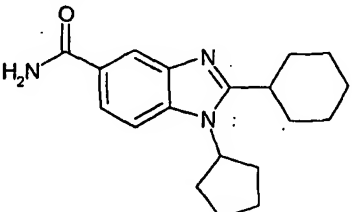
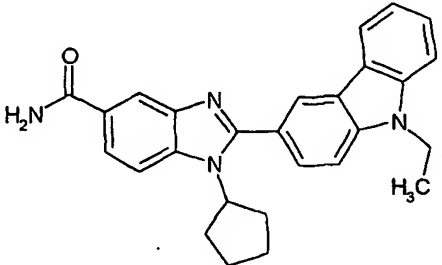
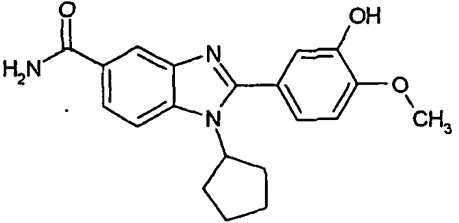
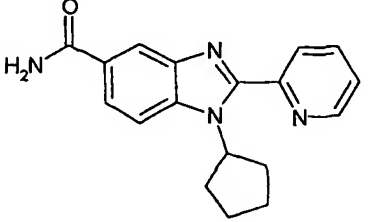
实施例 番号	式	MS
1042		417(M+H)
1043		440(M+H)
1044		312(M+H)
1045		423(M+H)
1046		352(M+H)
1047		307(M+H)



表79

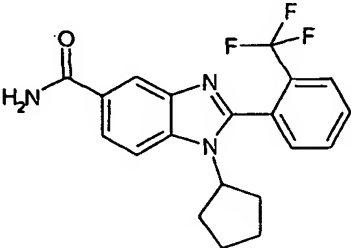
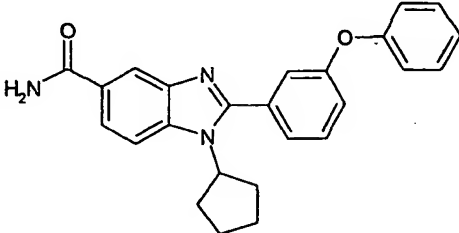
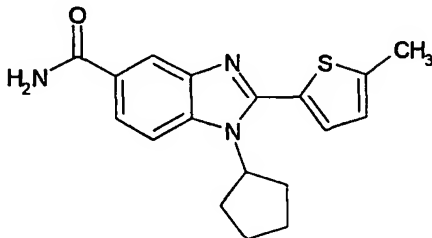
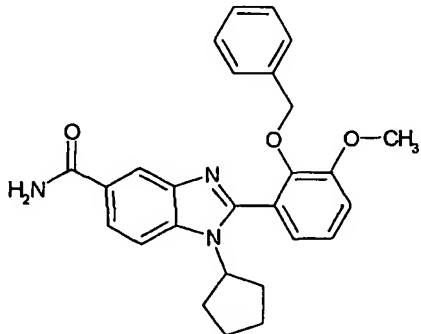
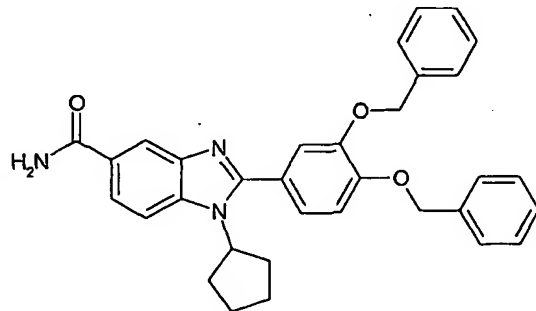
実施例 番号	式	MS
1048		374(M+H)
1049		398(M+H)
1050		326(M+H)
1051		442(M+H)
1052		518(M+H)

表80

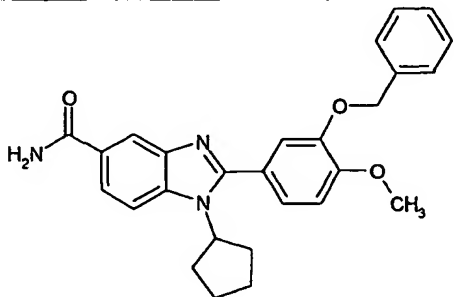
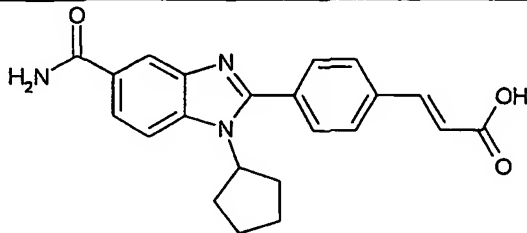
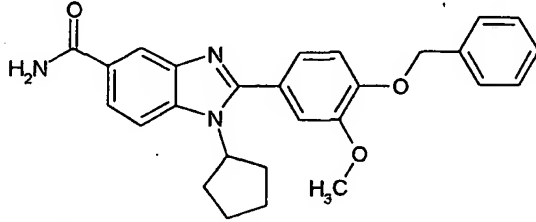
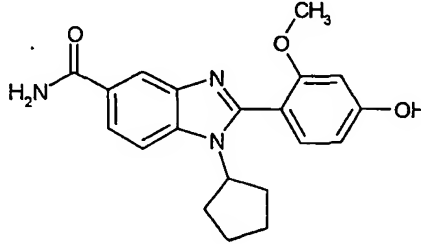
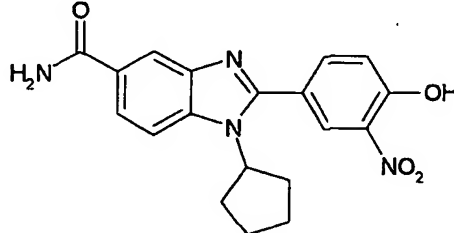
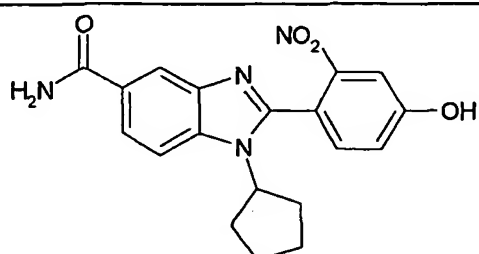
実施例 番号	式	MS
1053		442(M+H)
1054		376(M+H)
1055		442(M+H)
1056		352(M+H)
1057		367(M+H)
1058		367(M+H)

表81

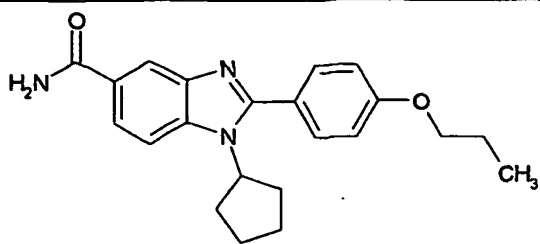
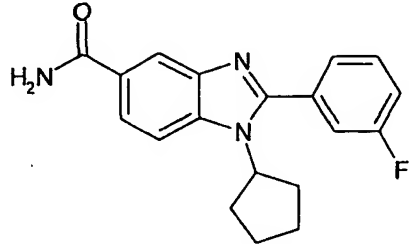
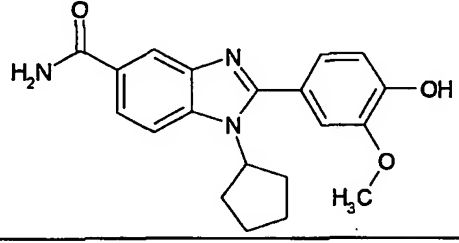
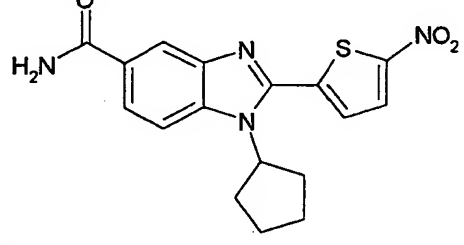
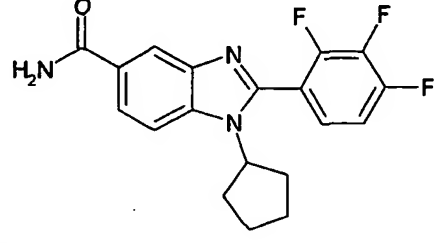
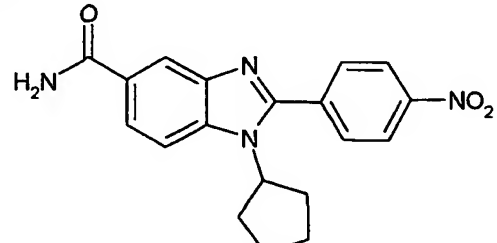
実施例 番号	式	MS
1059		364(M+H)
1060		324(M+H)
1061		352(M+H)
1062		357(M+H)
1063		360(M+H)
1064		351(M+H)

表82

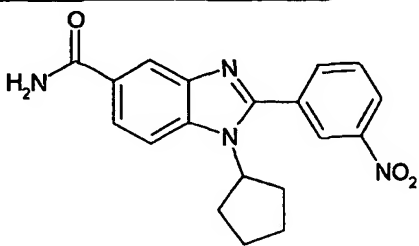
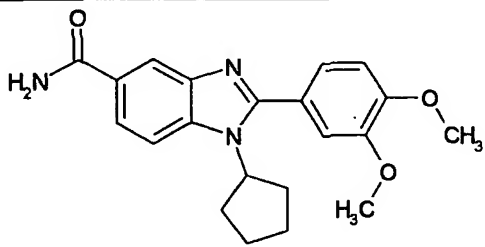
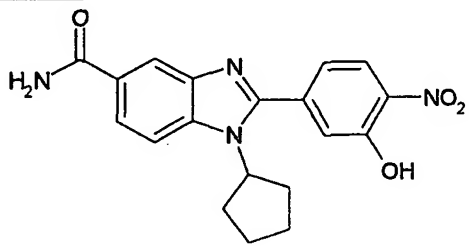
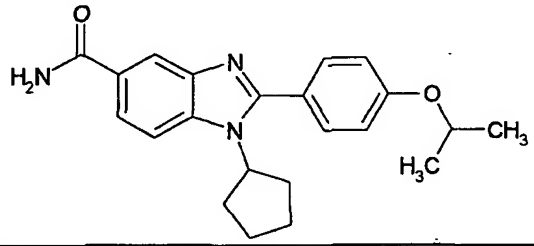
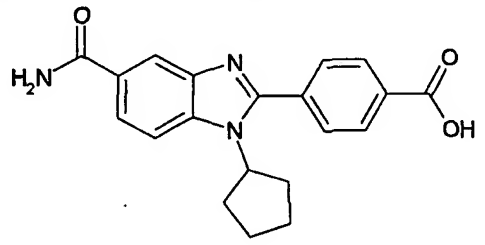
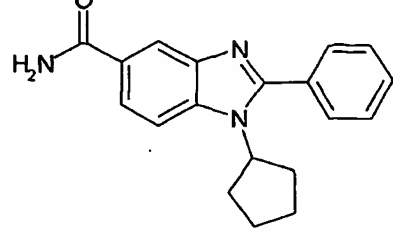
実施例 番号	式	MS
1065		351(M+H)
1066		366(M+H)
1067		367(M+H)
1068		364(M+H)
1069		350(M+H)
1070		306(M+H)

表83

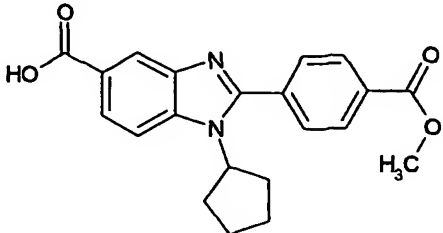
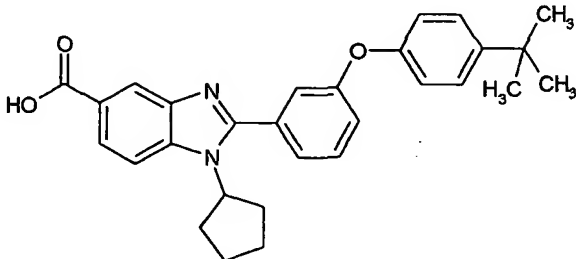
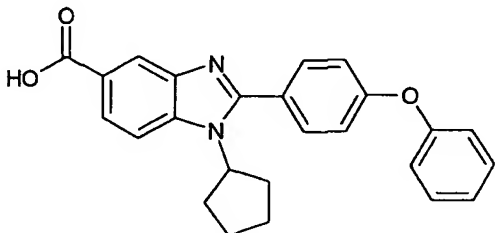
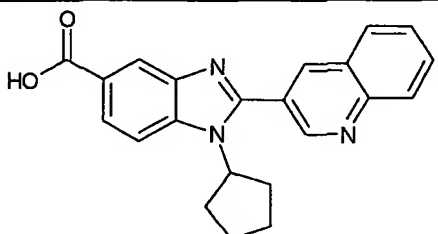
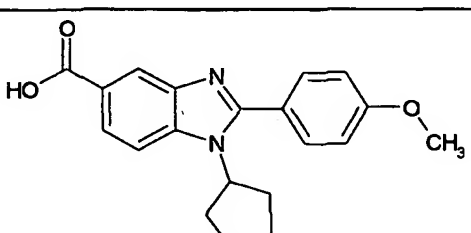
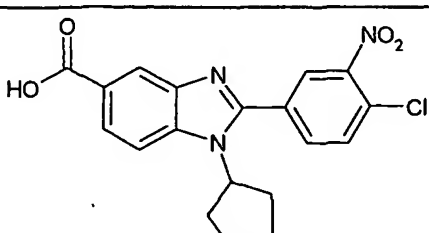
実施例 番号	式	MS
1071		365(M+H)
1072		455(M+H)
1073		399(M+H)
1074		358(M+H)
1075		337(M+H)
1076		386(M+H)

表84

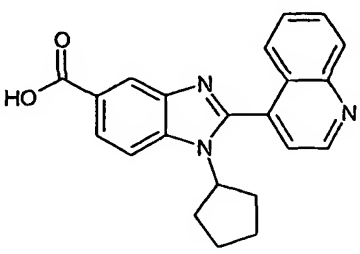
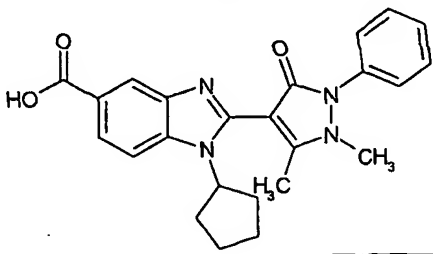
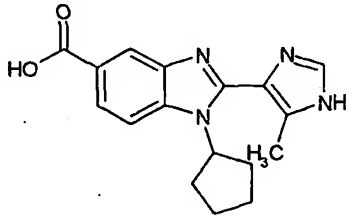
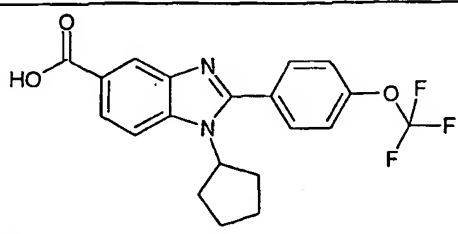
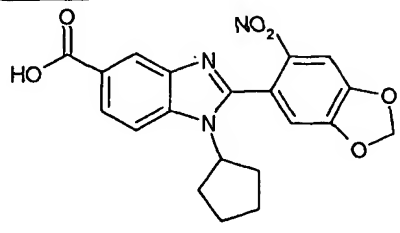
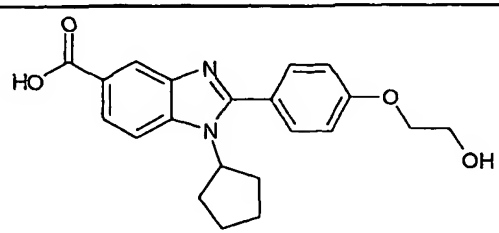
実施例 番号	式	MS
1077		358(M+H)
1078		417(M+H)
1079		311(M+H)
1080		391(M+H)
1081		396(M+H)
1082		367(M+H)

表85

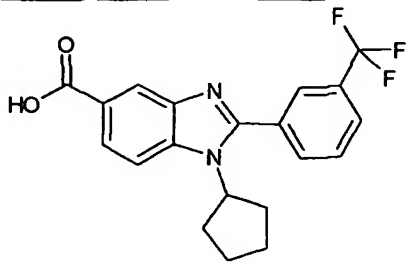
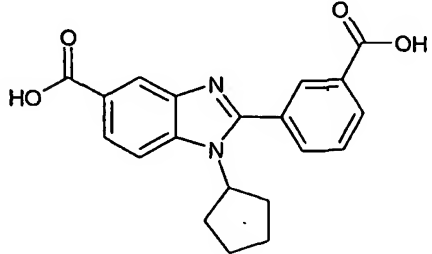
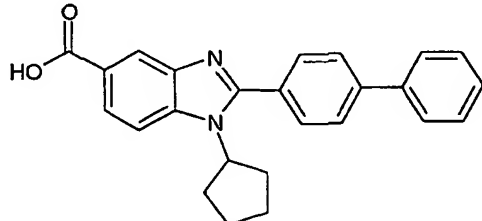
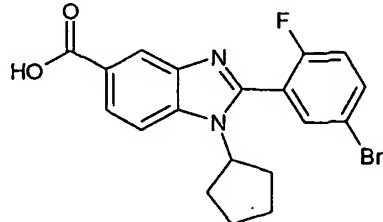
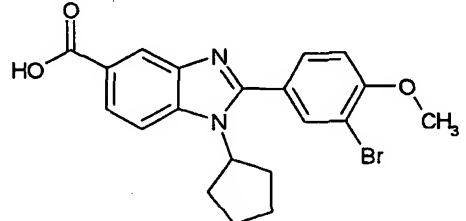
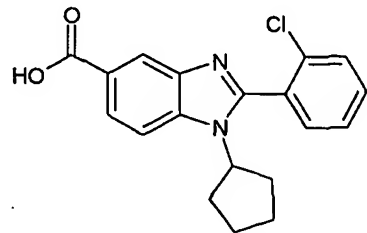
実施例 番号	式	MS
1083		375(M+H)
1084		351(M+H)
1085		383(M+H)
1086		403(M+H)
1087		415(M+H)
1088		341(M+H)

表86

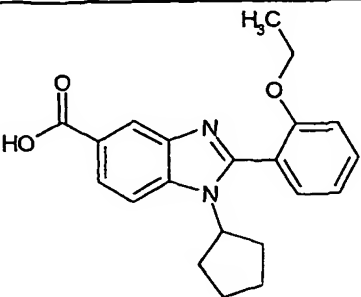
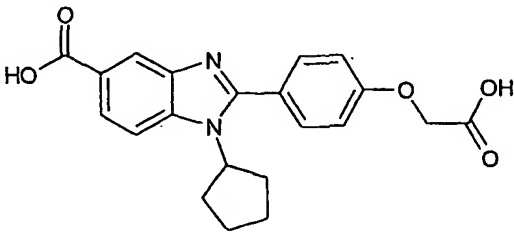
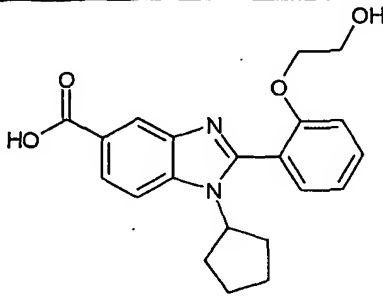
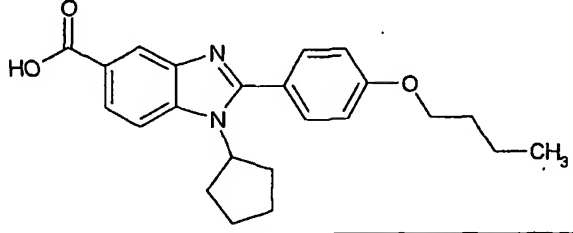
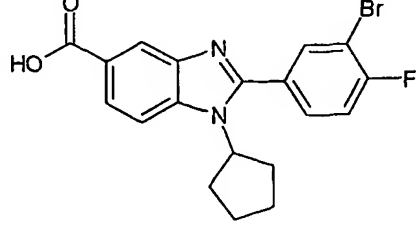
実施例 番号	式	MS
1089		351(M+H)
1090		381(M+H)
1091		367(M+H)
1092		379(M+H)
1093		403(M+H)



表87

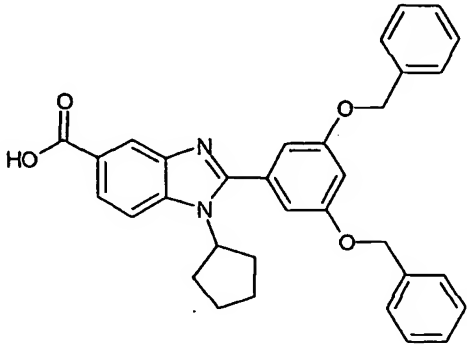
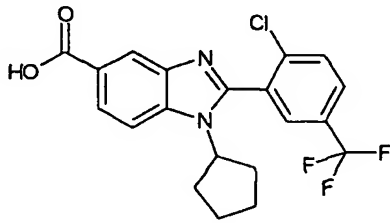
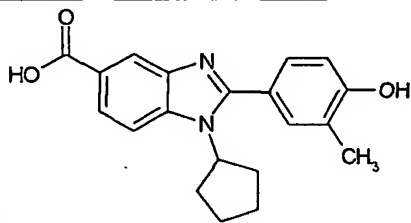
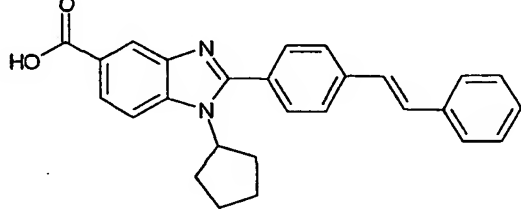
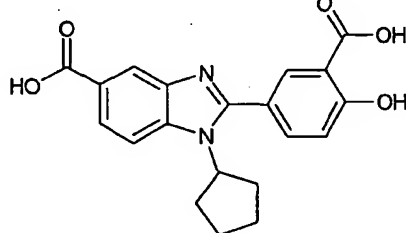
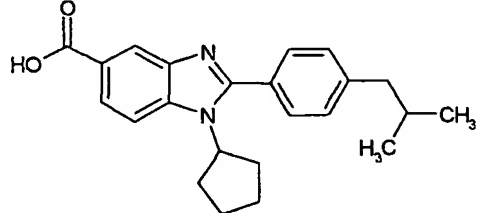
実施例 番号	式	MS
1094		519(M+H)
1095		409(M+H)
1096		337(M+H)
1097		409(M+H)
1098		367(M+H)
1099		363(M+H)

表88

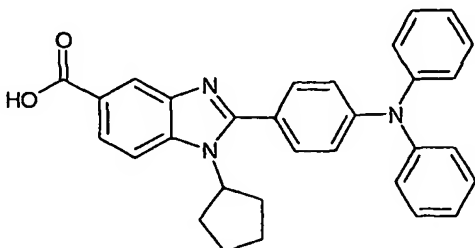
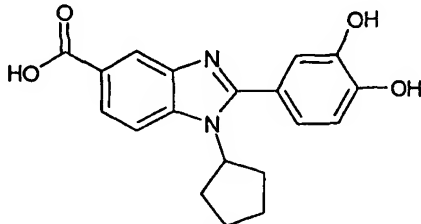
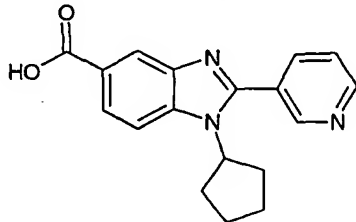
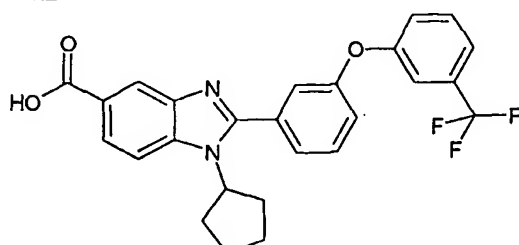
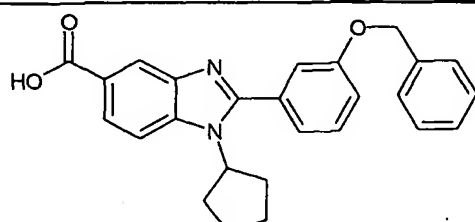
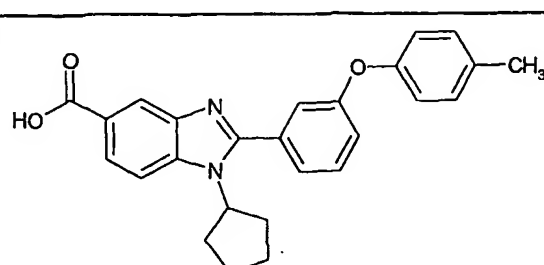
実施例 番号	式	MS
1100		474(M+H)
1101		339(M+H)
1102		308(M+H)
1103		467(M+H)
1104		413(M+H)
1105		413(M+H)

表89

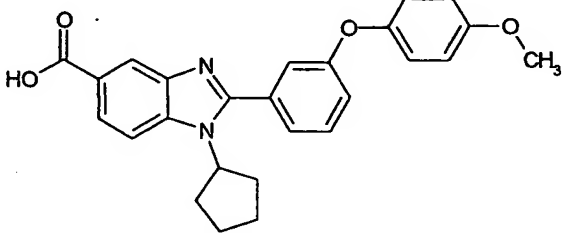
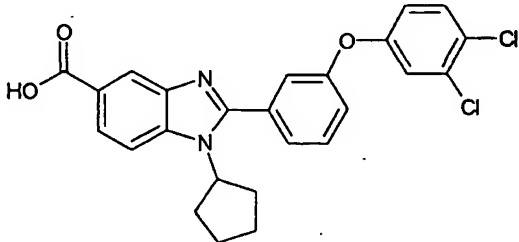
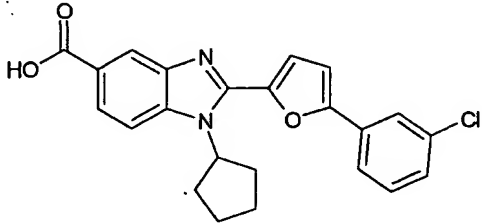
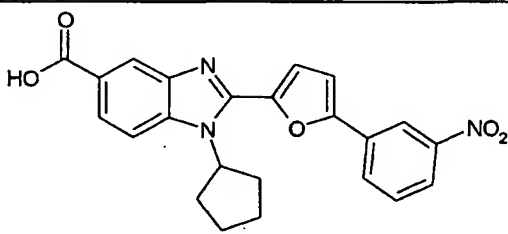
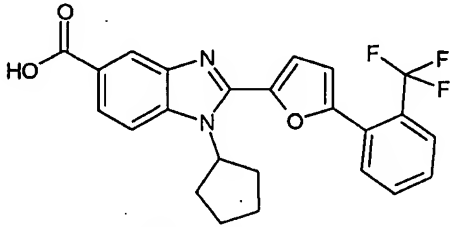
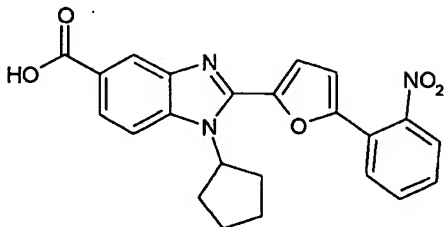
実施例 番号	式	MS
1106		429(M+H)
1107		467(M+H)
1108		
1109		
1110		441(M+H)
1111		418(M+H)

表90

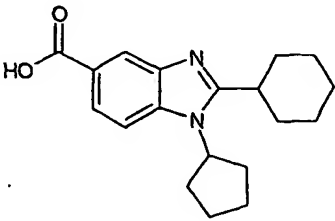
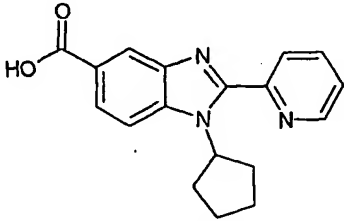
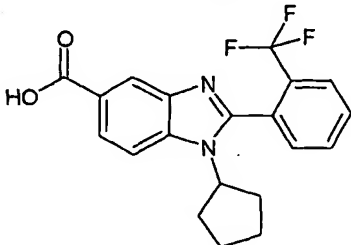
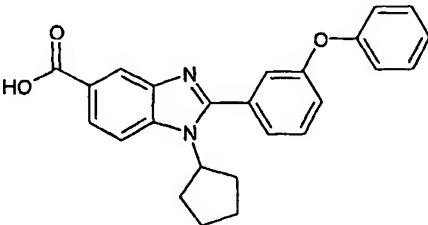
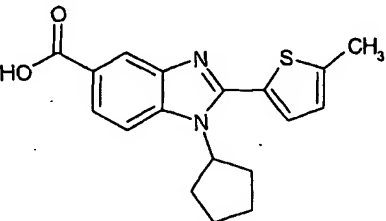
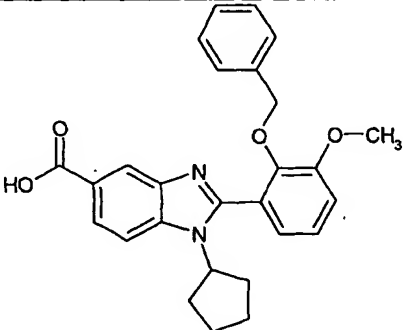
実施例 番号	式	MS
1112		313(M+H)
1113		308(M+H)
1114		375(M+H)
1115		399(M+H)
1116		327(M+H)
1117		443(M+H)

表91

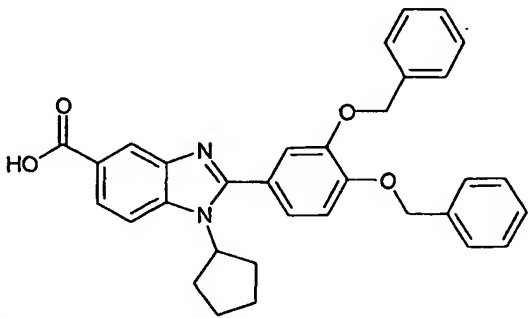
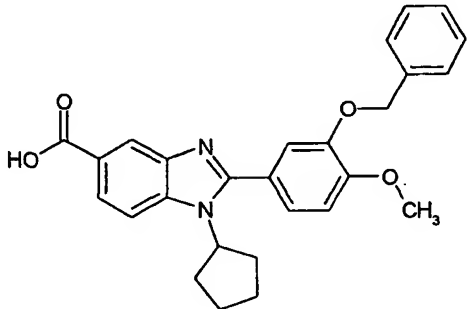
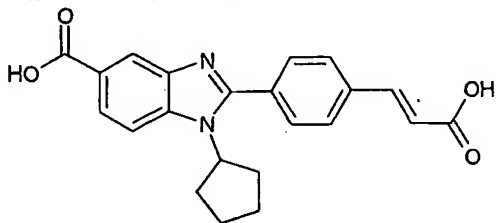
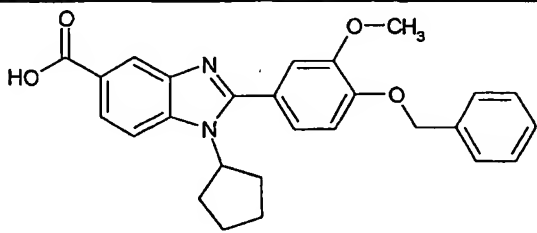
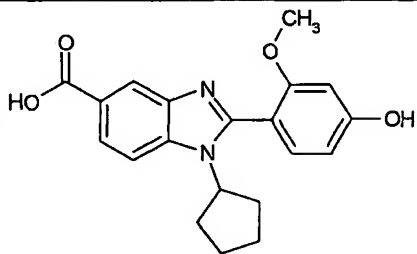
実施例 番号	式	MS
1118		519(M+H)
1119		443(M+H)
1120		377(M+H)
1121		443(M+H)
1122		353(M+H)

表92

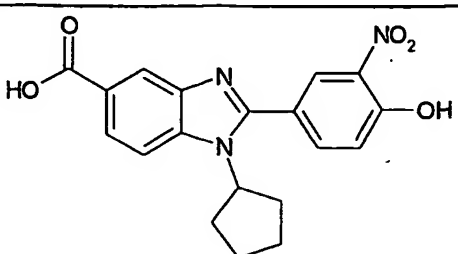
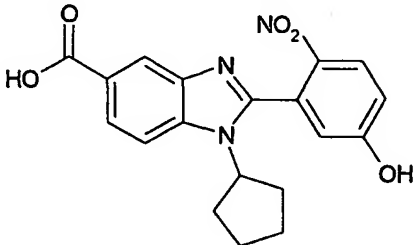
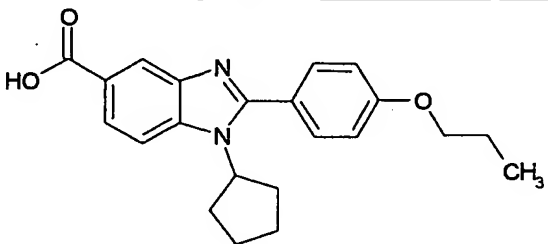
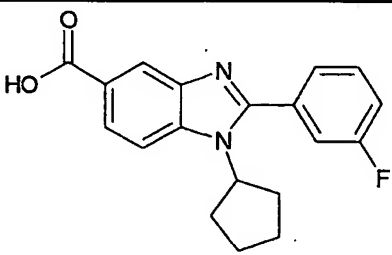
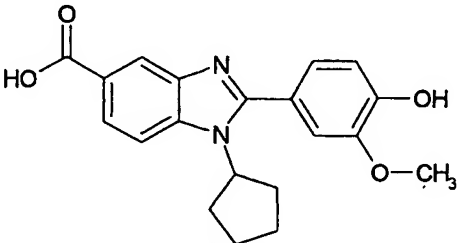
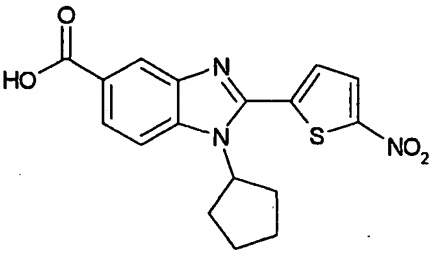
実施例 番号	式	MS
1123		368(M+H)
1124		368(M+H)
1125		365(M+H)
1126		325(M+H)
1127		353(M+H)
1128		358(M+H)

表93

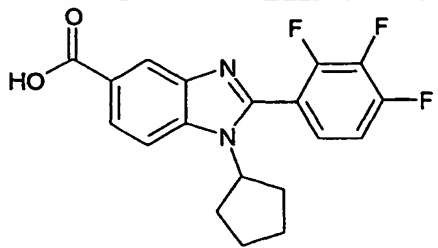
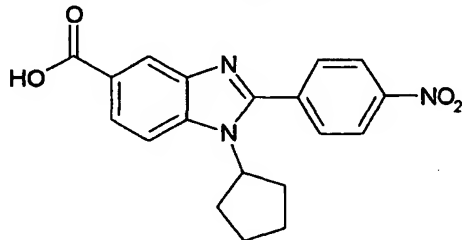
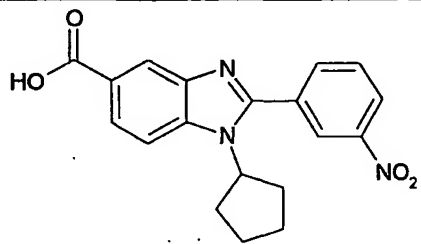
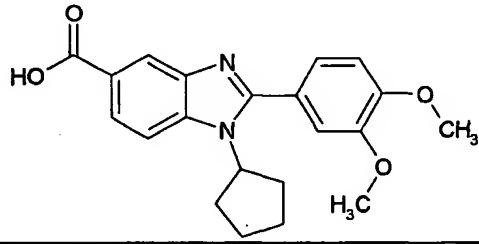
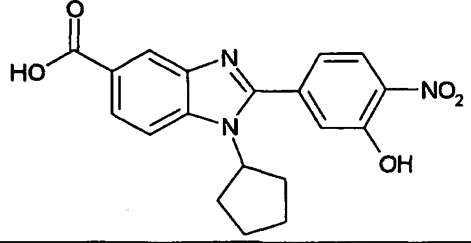
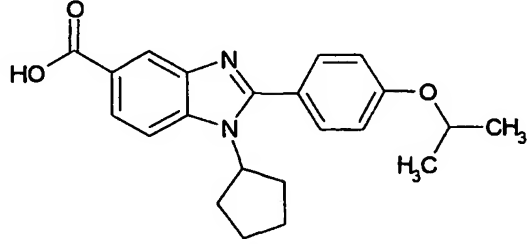
実施例 番号	式	MS
1129		361(M+H)
1130		352(M+H)
1131		352(M+H)
1132		367(M+H)
1133		368(M+H)
1134		365(M+H)

表94

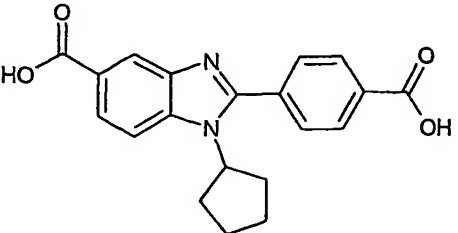
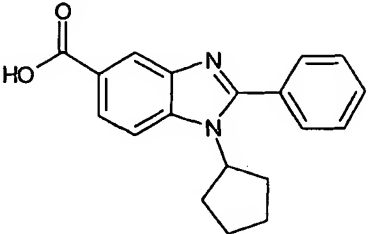
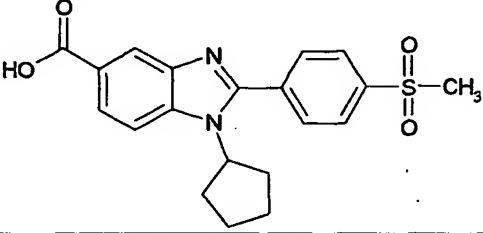
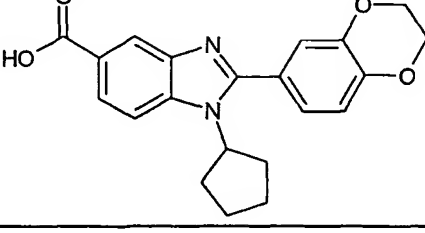
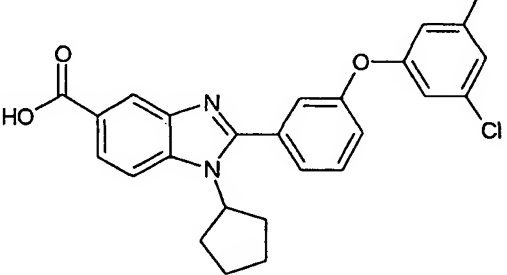
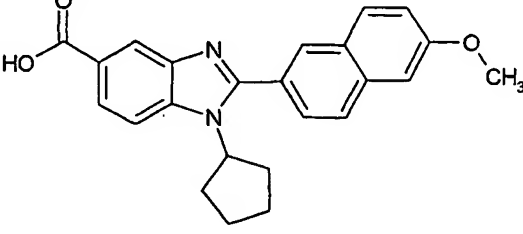
実施例 番号	式	MS
1135		351(M+H)
1136		307(M+H)
1137		385(M+H)
1138		365(M+H)
1139		467(M+H)
1140		387(M+H)



表95

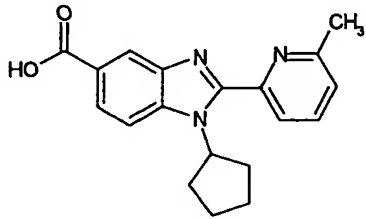
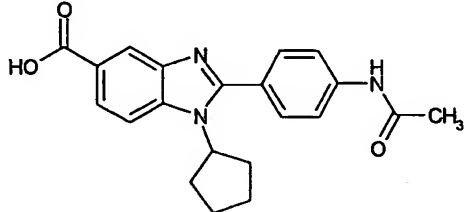
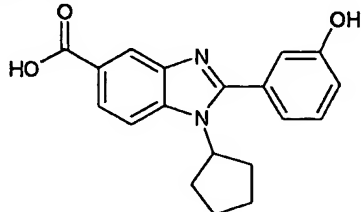
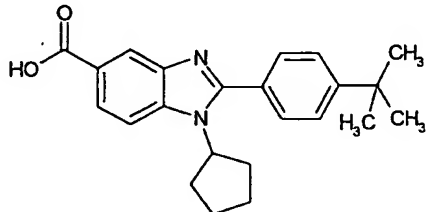
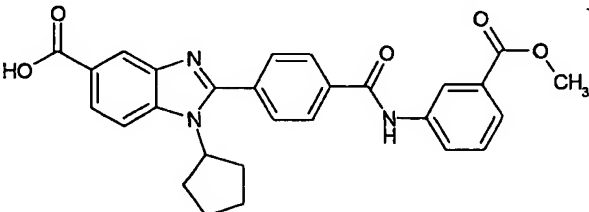
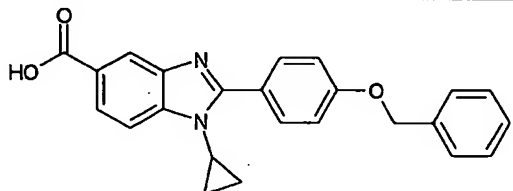
実施例 番号	式	MS
1141		322(M+H)
1142		364(M+H)
1143		323(M+H)
1144		363(M+H)
1145		484(M+H)
1146		385(M+H)

表96

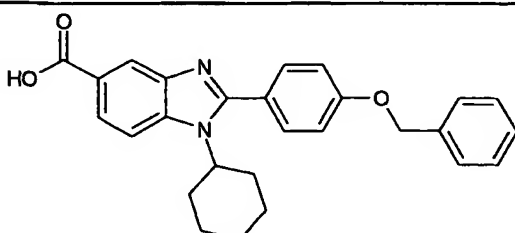
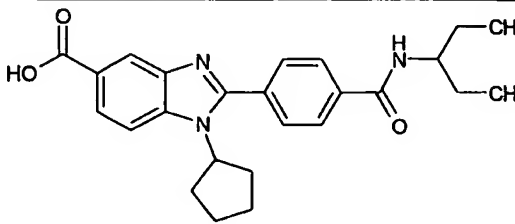
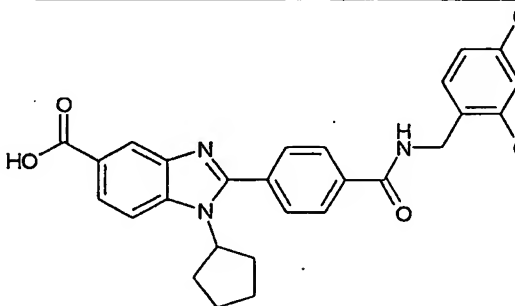
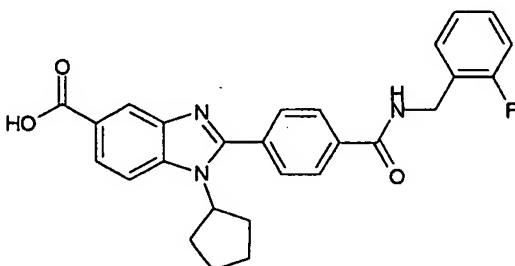
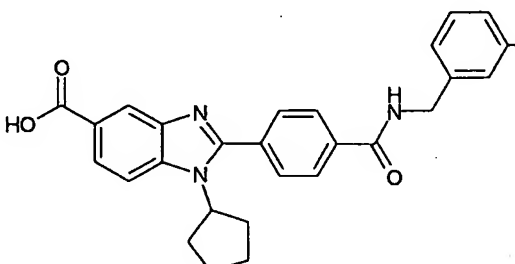
実施例 番号	式	MS
1147		427(M+H)
1148		420(M+H)
1149		508(M+H)
1150		458(M+H)
1151		458(M+H)

表97

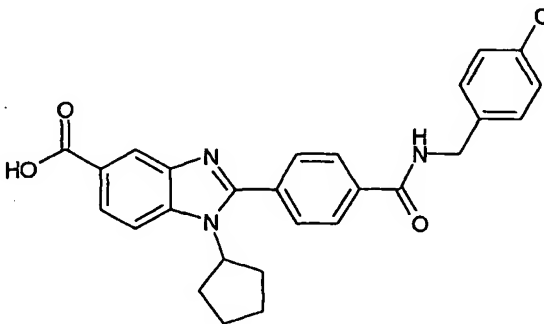
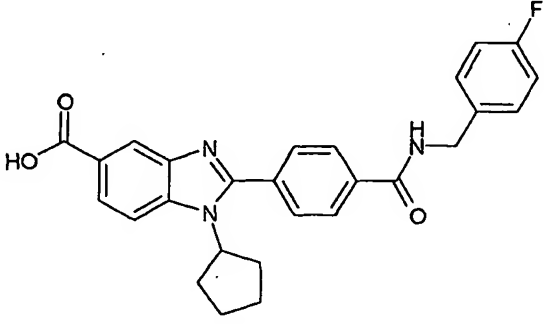
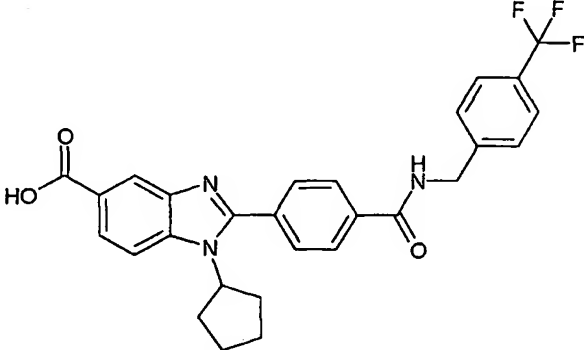
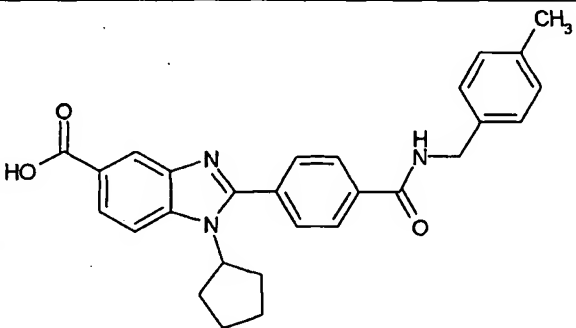
実施例 番号	式	MS
1152		474(M+H)
1153		458(M+H)
1154		508(M+H)
1155		454(M+H)

表98

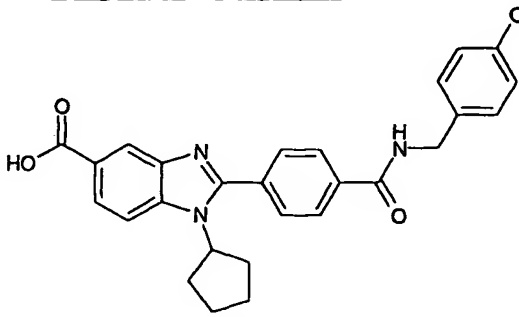
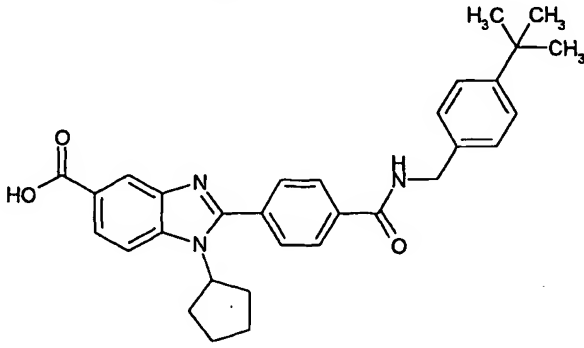
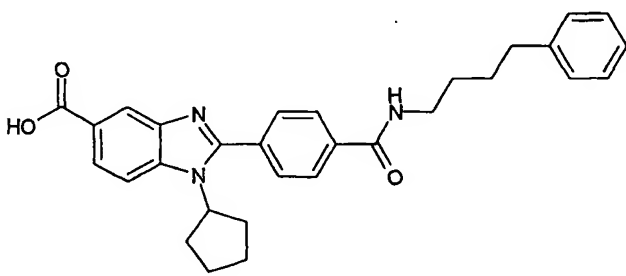
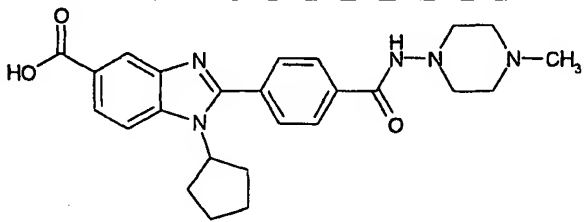
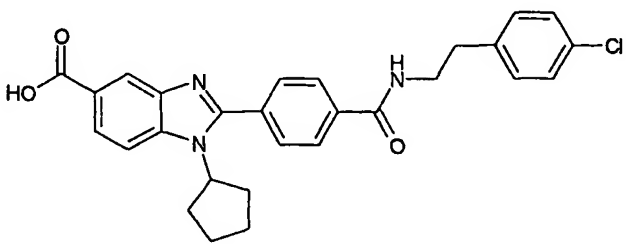
実施例 番号	式	MS
1156		470(M+H)
1157		496(M+H)
1158		482(M+H)
1159		448(M+H)
1160		488(M+H)

表99

実施例 番号	式	MS
1161		468(M+H)
1162		447(M+H)
1163		466(M+H)
1164		526(M+H)
1165		420(M+H)

表100

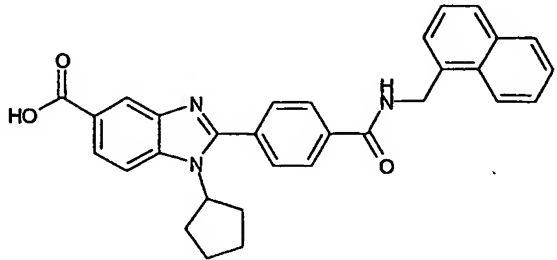
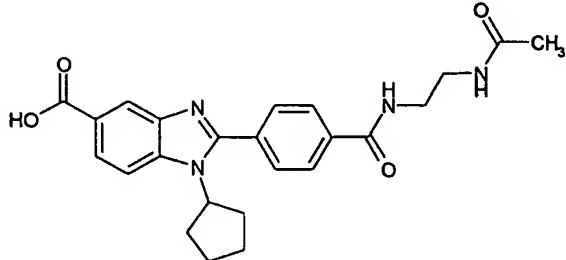
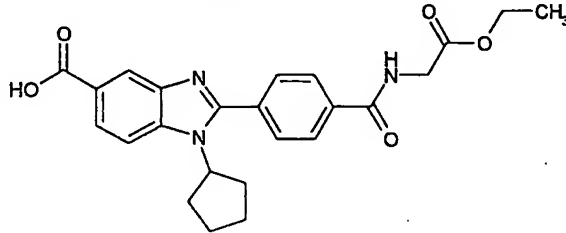
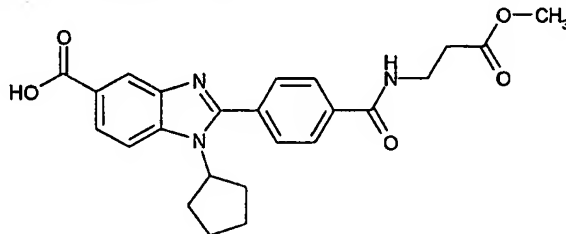
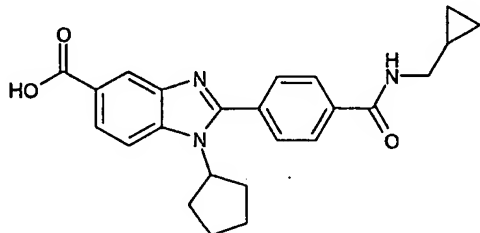
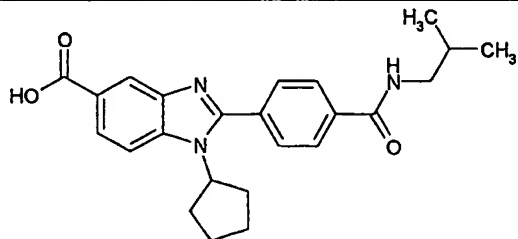
実施例 番号	式	MS
1166		490(M+H)
1167		435(M+H)
1168		436(M+H)
1169		436(M+H)
1170		404(M+H)
1171		406(M+H)

表101

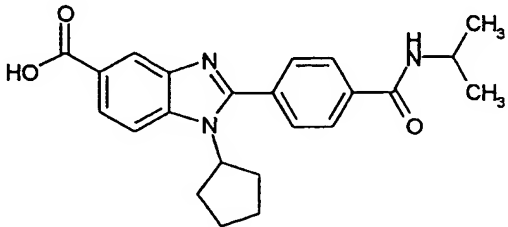
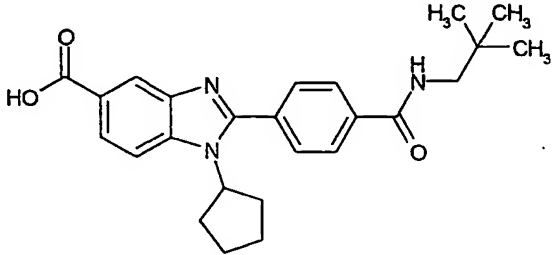
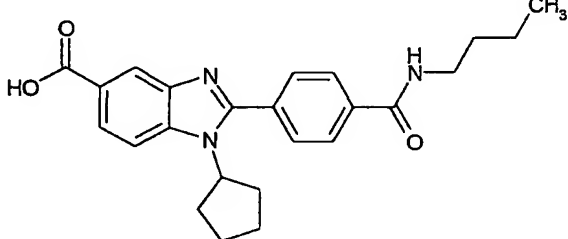
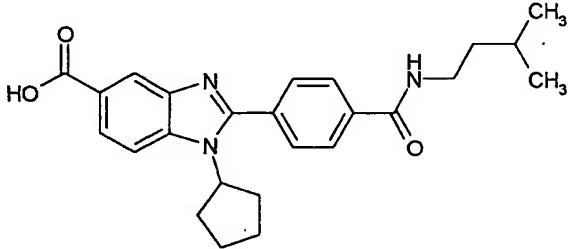
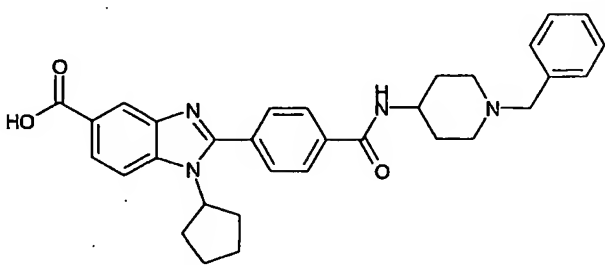
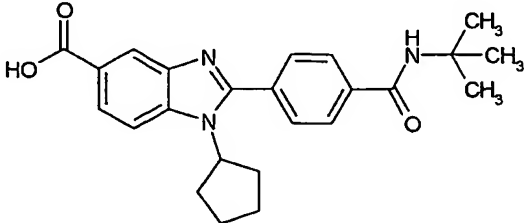
実施例 番号	式	MS
1172		392(M+H)
1173		420(M+H)
1174		406(M+H)
1175		420(M+H)
1176		523(M+H)
1177		406(M+H)

表102

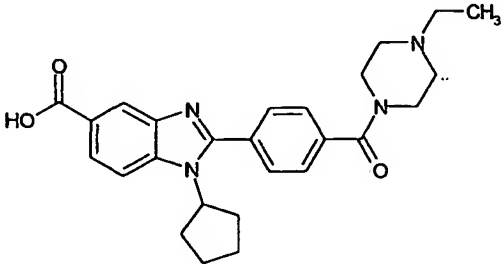
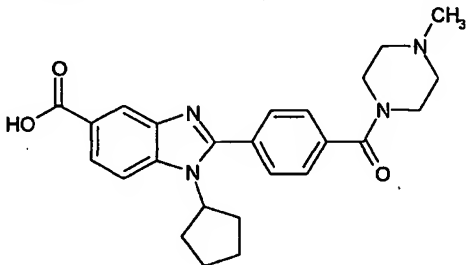
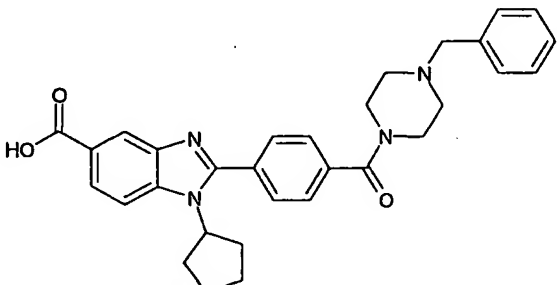
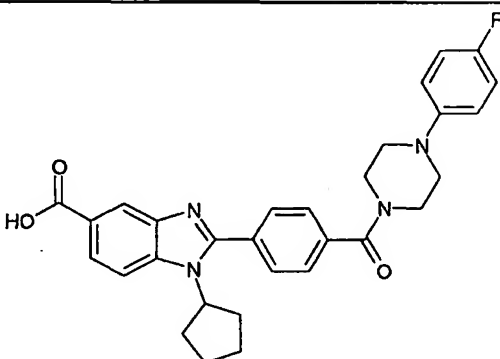
実施例 番号	式	MS
1178		447(M+H)
1179		433(M+H)
1180		509(M+H)
1181		513(M+H)



表103

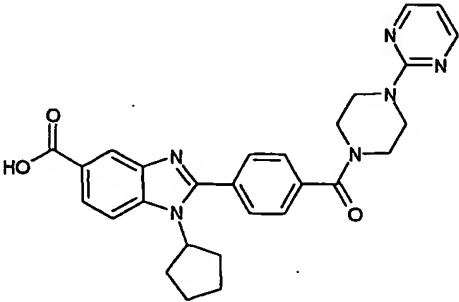
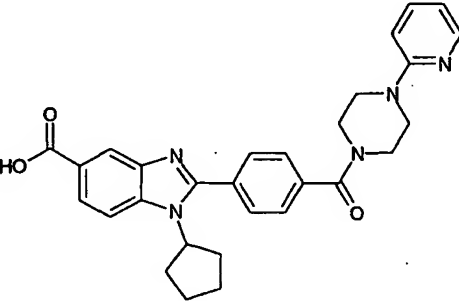
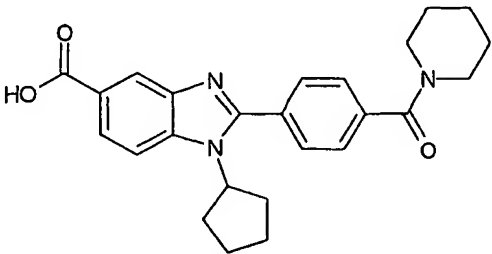
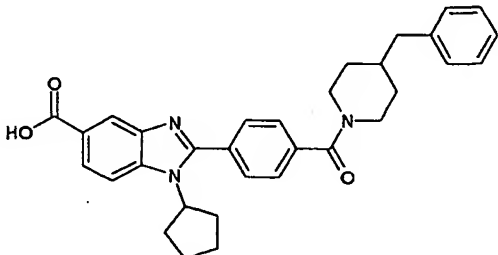
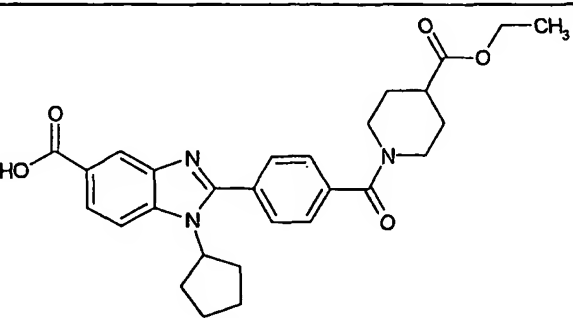
実施例 番号	式	MS
1182		497(M+H)
1183		496(M+H)
1184		418(M+H)
1185		508(M+H)
1186		490(M+H)

表104

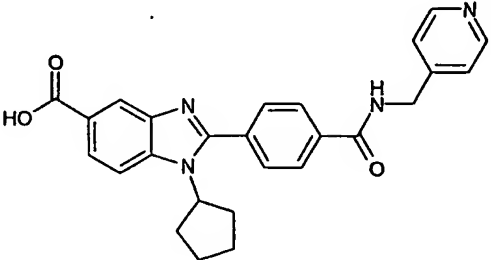
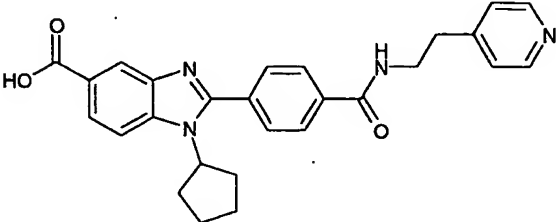
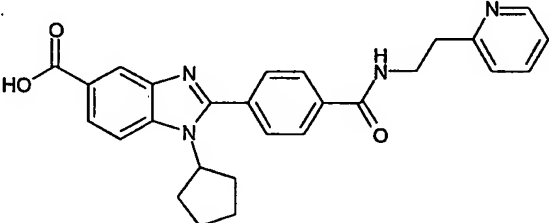
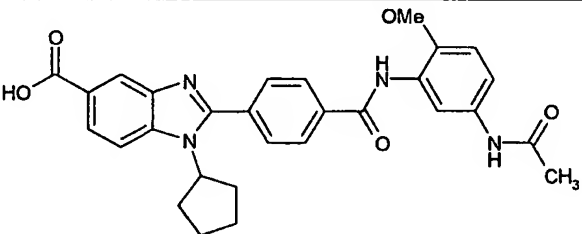
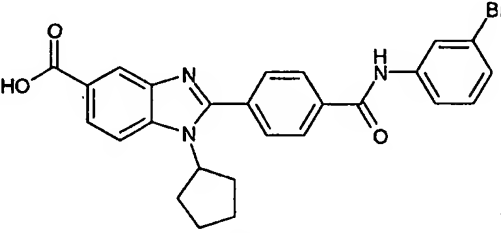
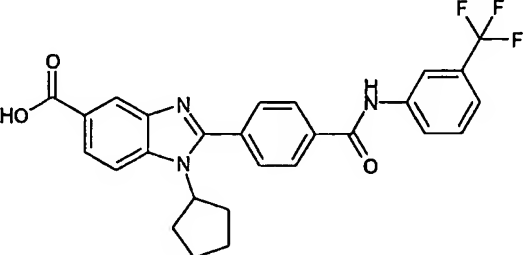
実施例 番号	式	MS
1187		441(M+H)
1188		455(M+H)
1189		455(M+H)
1190		513(M+H)
1191		504(M+H)
1192		494(M+H)

表105

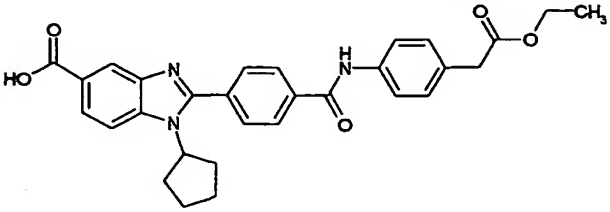
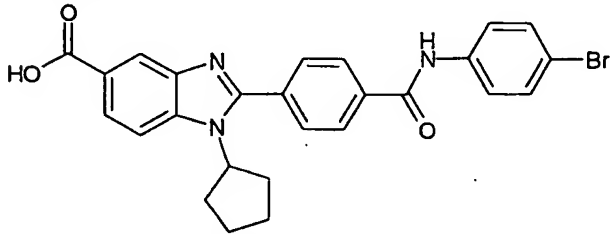
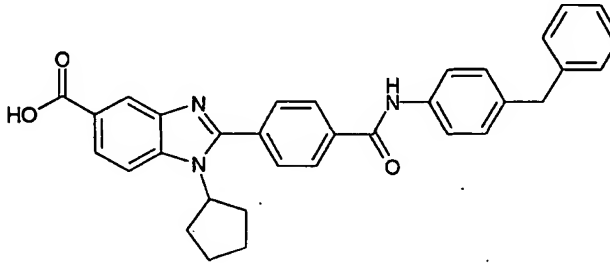
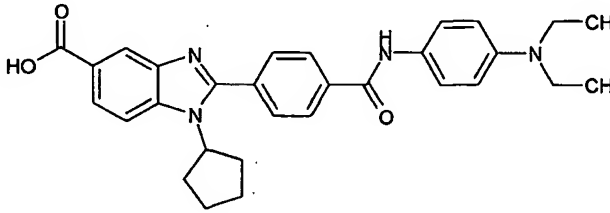
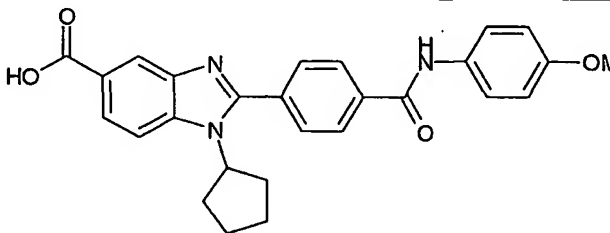
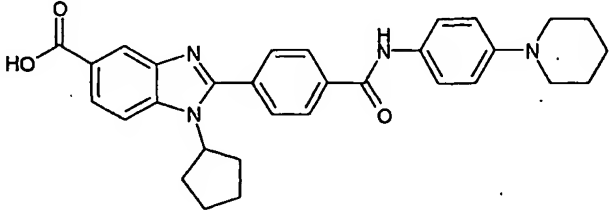
实施例 番号	式	MS
1193		512(M+H)
1194		504(M+H)
1195		516(M+H)
1196		497(M+H)
1197		456(M+H)
1198		509(M+H)

表106

実施例 番号	式	MS
1199		483(M+H)
1200		427(M+H)
1201		427(M+H)
1202		477(M+H)
1203		519(M+H)
1204		440(M+H)

表107

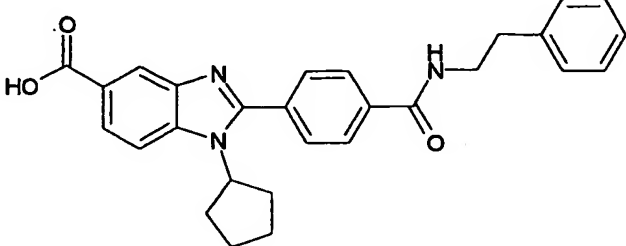
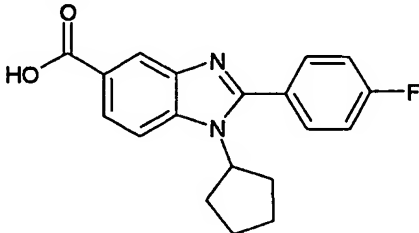
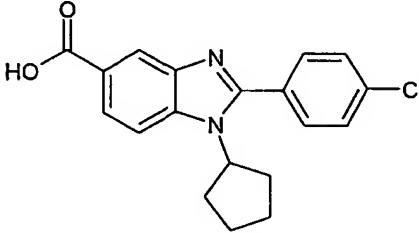
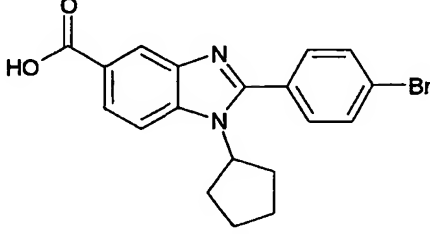
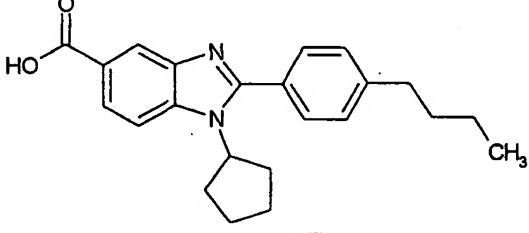
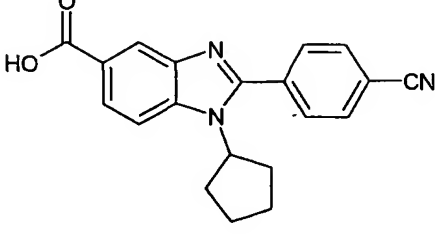
実施例 番号	式	MS
1205		454(M+H)
1206		325(M+H)
1207		341(M+H)
1208		385(M+H)
1209		363(M+H)
1210		332(M+H)

表108

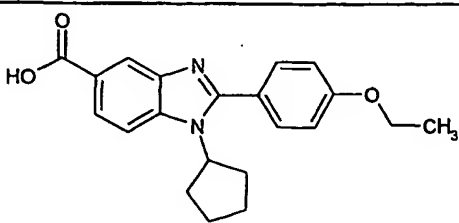
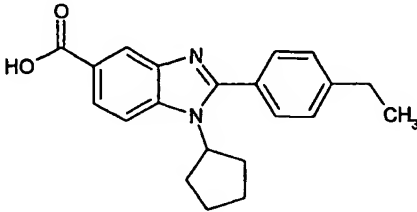
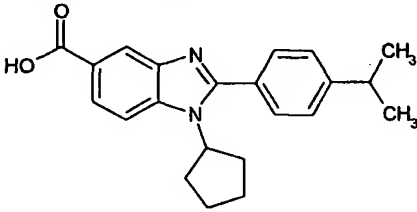
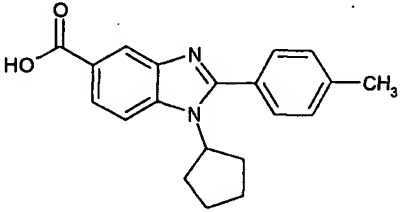
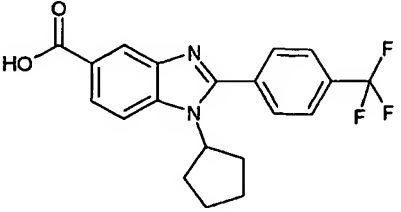
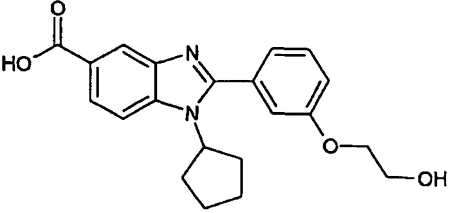
実施例 番号	式	MS
1211		351(M+H)
1212		335(M+H)
1213		349(M+H)
1214		321(M+H)
1215		375(M+H)
1216		367(M+H)

表109

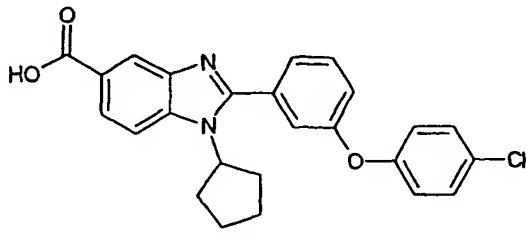
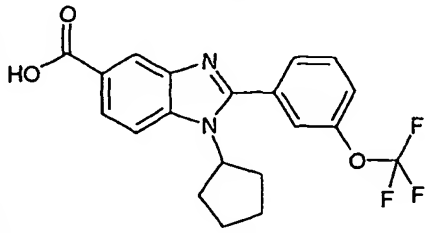
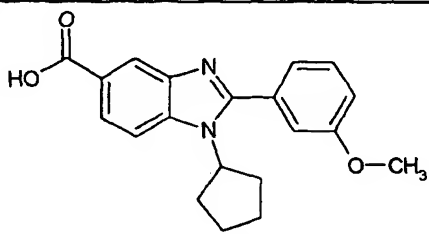
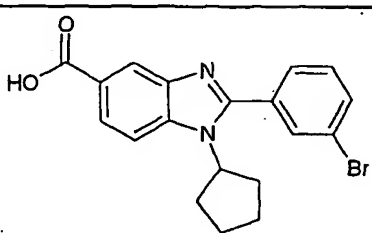
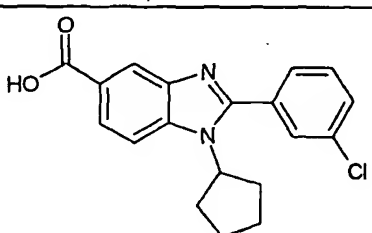
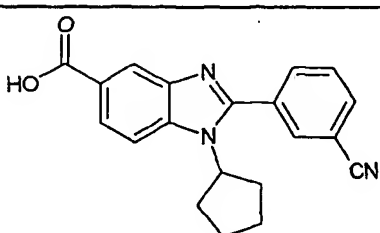
実施例 番号	式	MS
1217		433(M+H)
1218		391(M+H)
1219		337(M+H)
1220		385(M+H)
1221		341(M+H)
1222		332(M+H)

表110

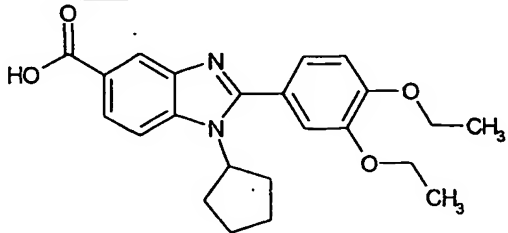
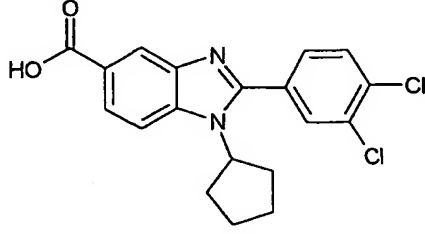
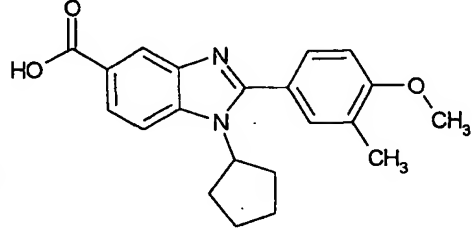
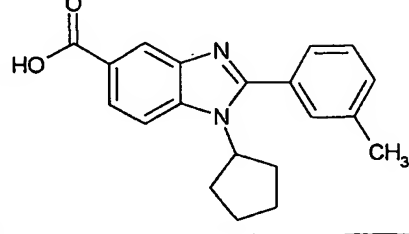
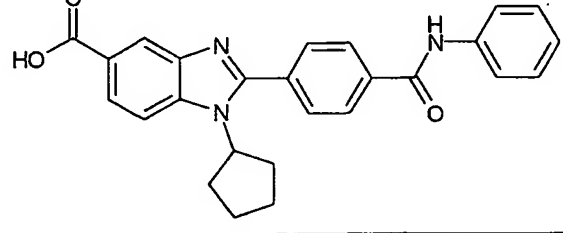
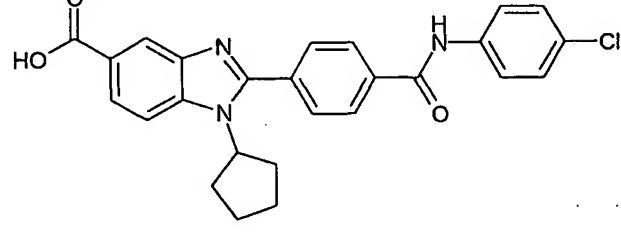
実施例 番号	式	MS
1223		395(M+H)
1224		375(M+H)
1225		351(M+H)
1226		321(M+H)
1227		426(M+H)
1228		460(M+H)



表111

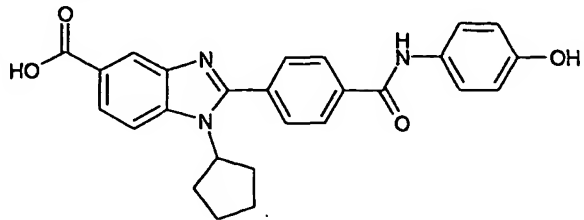
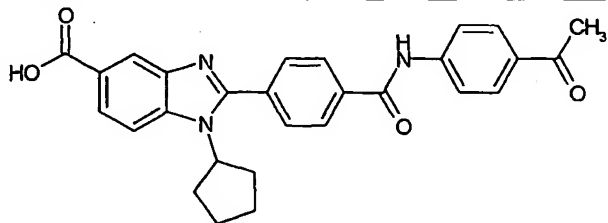
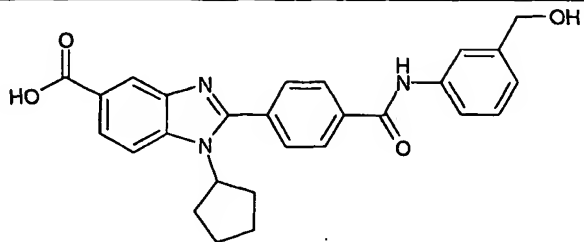
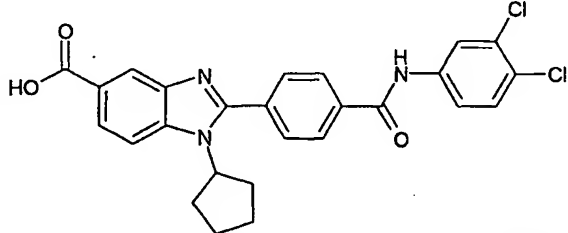
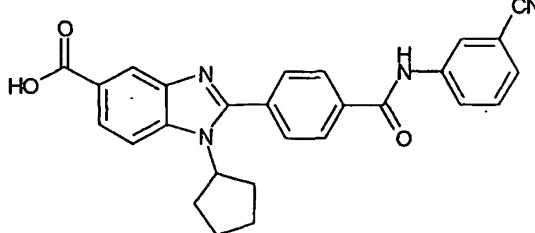
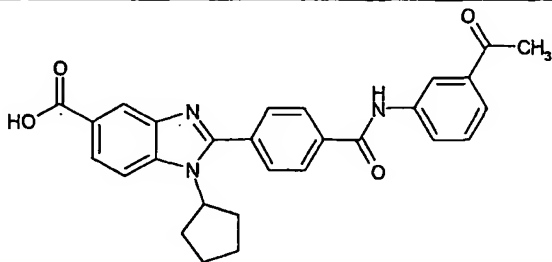
実施例 番号	式	MS
1229		442(M+H)
1230		468(M+H)
1231		456(M+H)
1232		494(M+H)
1233		451(M+H)
1234		468(M+H)

表112

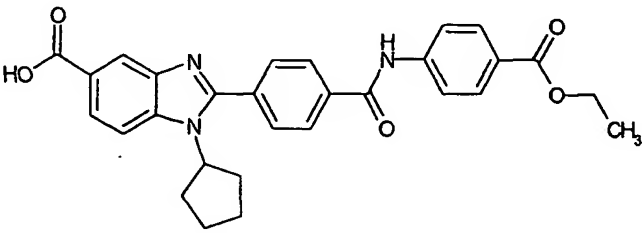
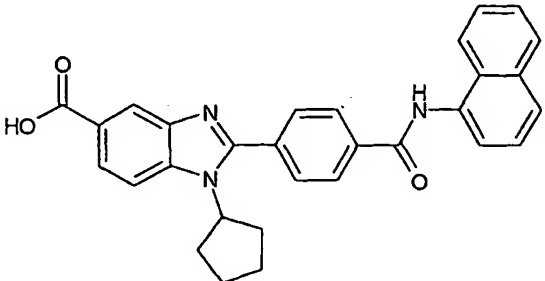
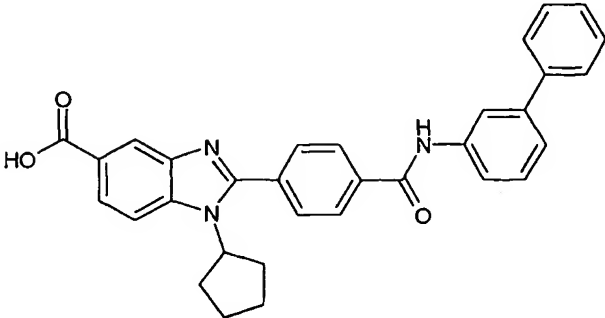
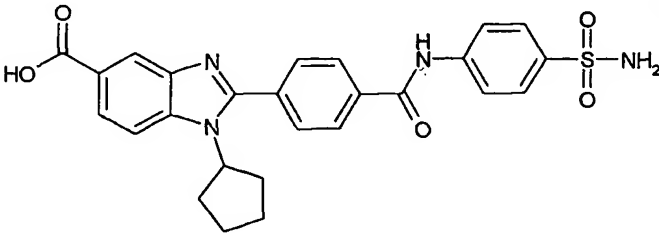
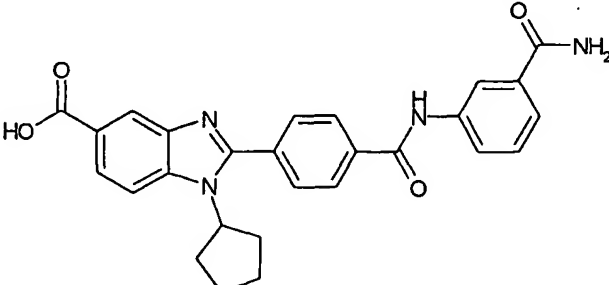
実施例 番号	式	MS
1235		498(M+H)
1236		476(M+H)
1237		502(M+H)
1238		505(M+H)
1239		469(M+H)

表113

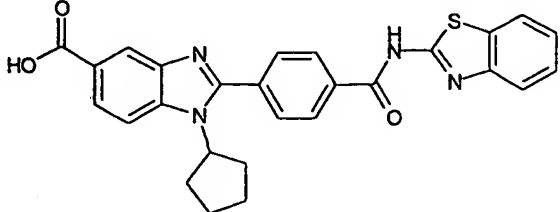
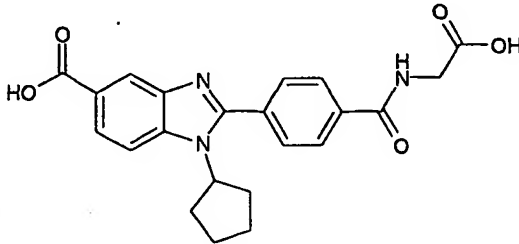
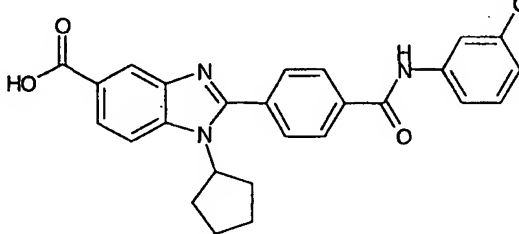
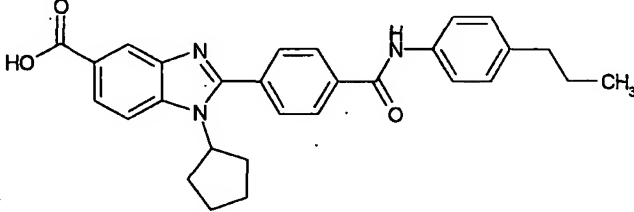
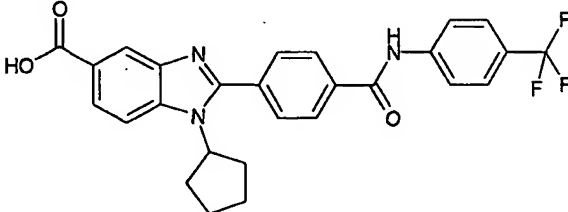
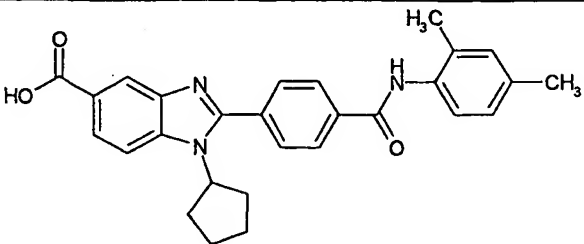
実施例 番号	式	MS
1240		483(M+H)
1241		408(M+H)
1242		460(M+H)
1243		468(M+H)
1244		494(M+H)
1245		454(M+H)

表114

実施例 番号	式	MS
1246		468(M+H)
1247		498(M+H)
1248		482(M+H)
1249		468(M+H)
1250		460(M+H)

表115

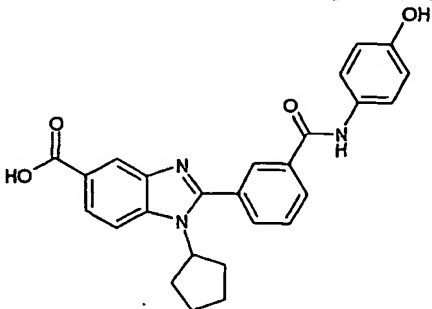
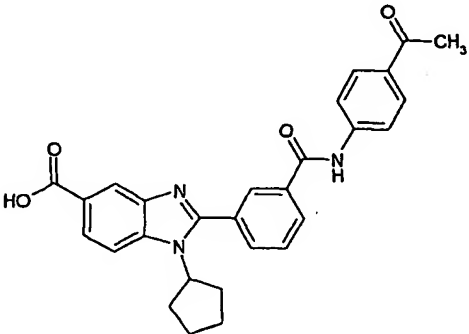
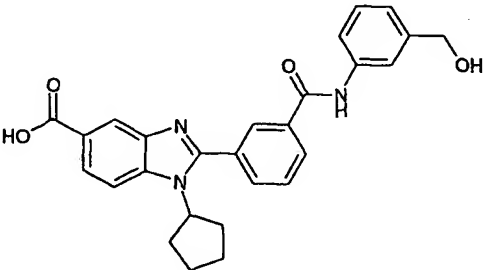
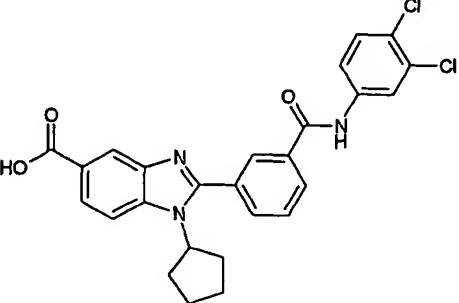
実施例 番号	式	MS
1251		442(M+H)
1252		468(M+H)
1253		456(M+H)
1254		494(M+H)

表116

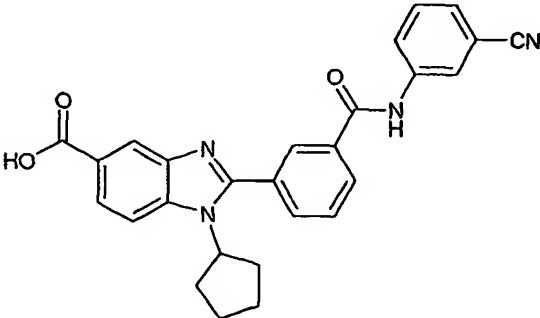
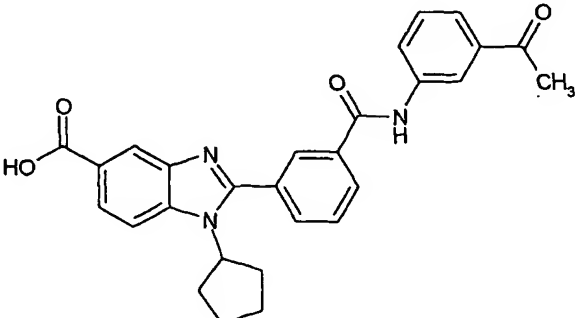
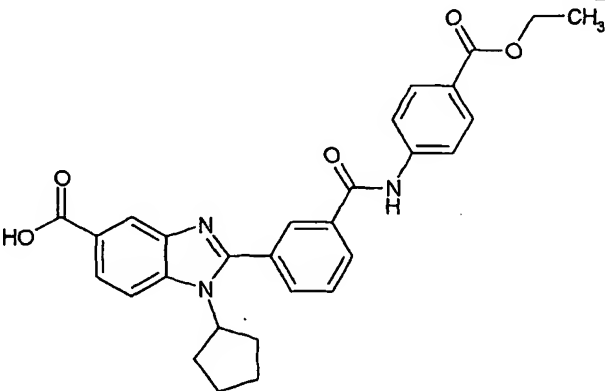
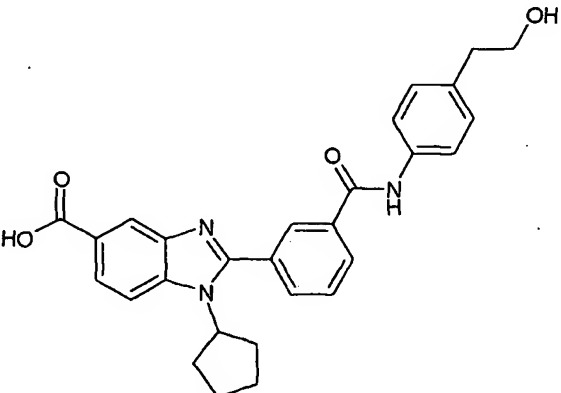
実施例 番号	式	MS
1255		451(M+H)
1256		468(M+H)
1257		498(M+H)
1258		470(M+H)

表117

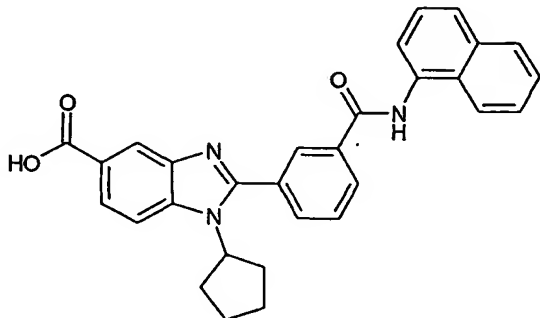
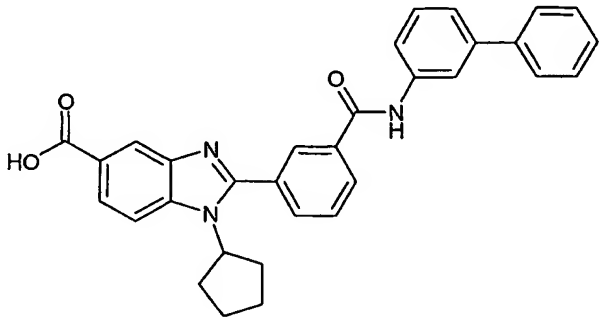
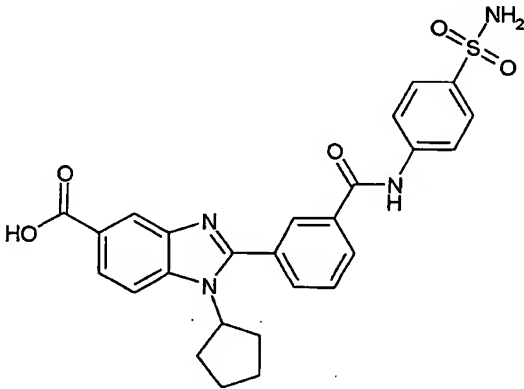
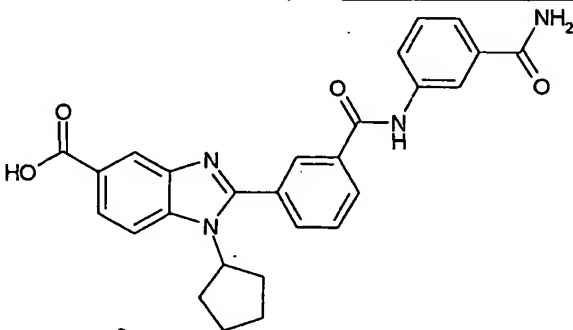
実施例 番号	式	MS
1259		476(M+H)
1260		502(M+H)
1261		505(M+H)
1262		469(M+H)

表118

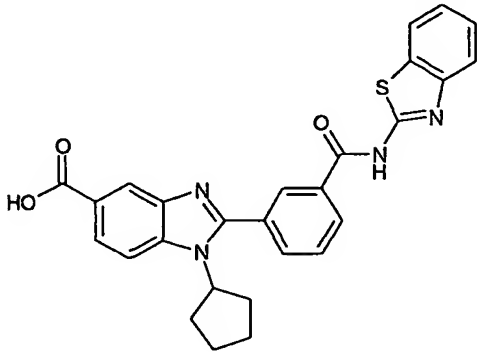
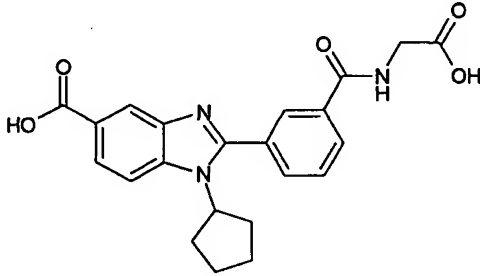
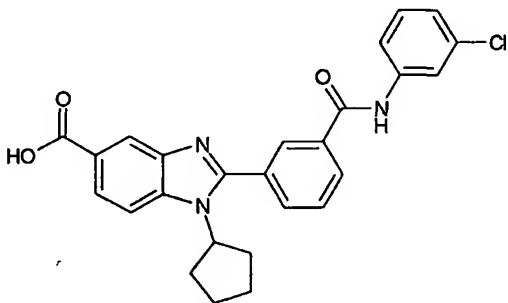
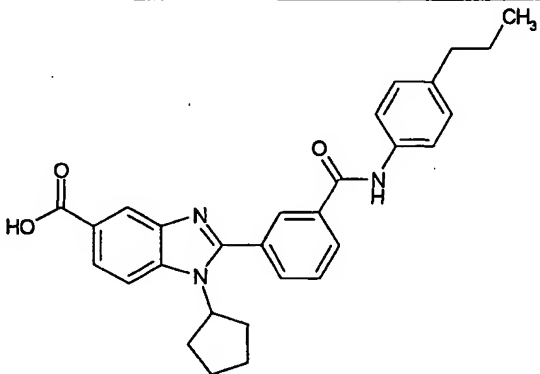
実施例 番号	式	MS
1263		483(M+H)
1264		408(M+H)
1265		460(M+H)
1266		468(M+H)



表119

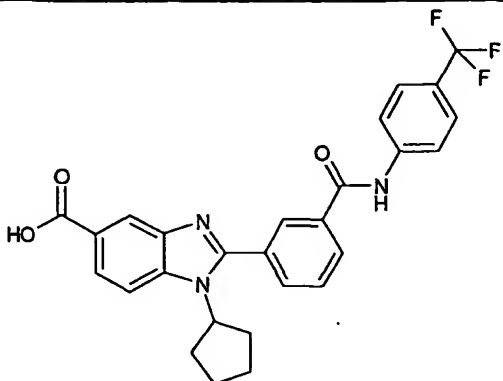
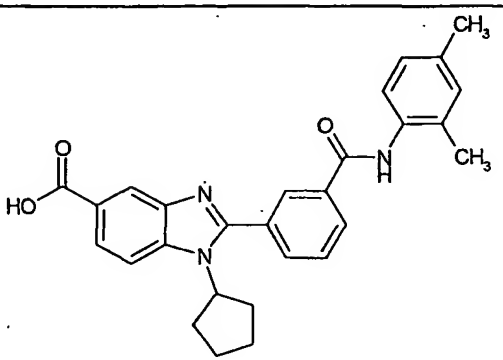
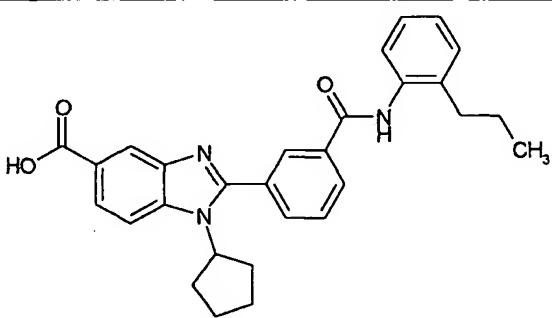
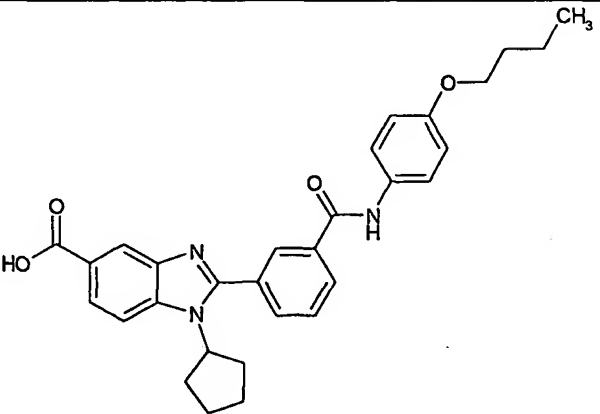
実施例 番号	式	MS
1267		494(M+H)
1268		454(M+H)
1269		468(M+H)
1270		498(M+H)

表120

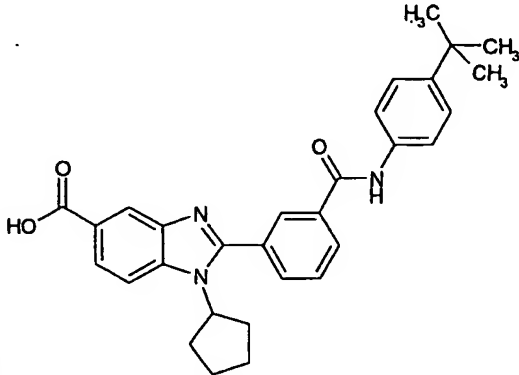
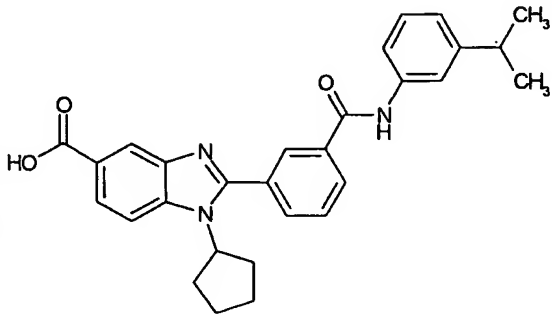
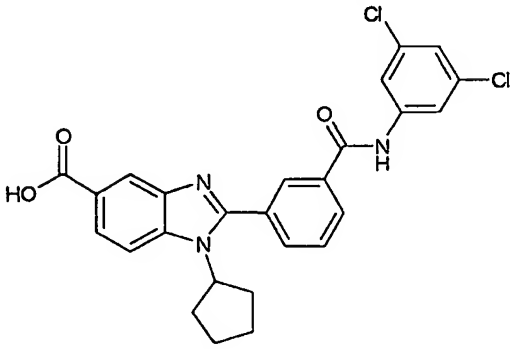
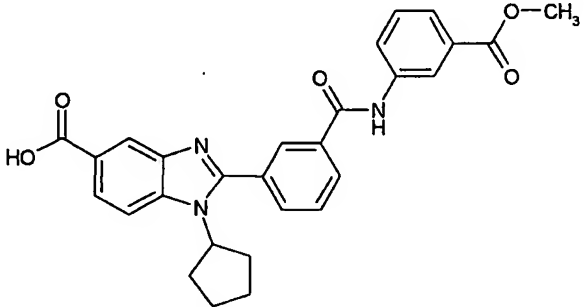
実施例 番号	式	MS
1271		482(M+H)
1272		468(M+H)
1273		494(M+H)
1274		484(M+H)

表121

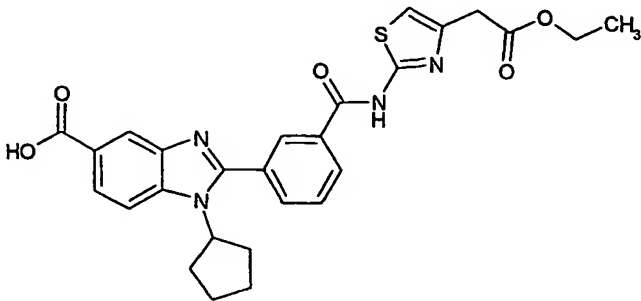
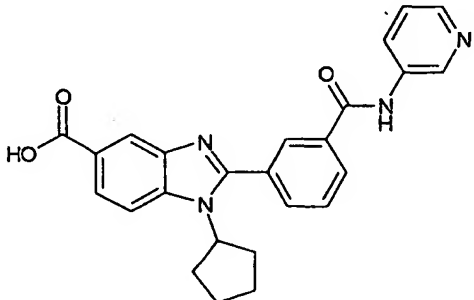
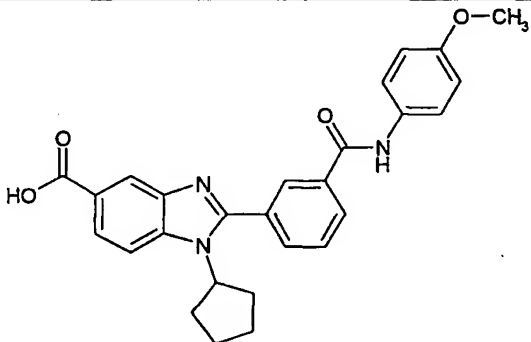
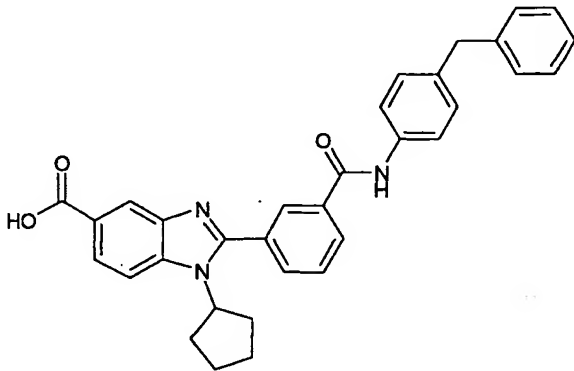
实施例 番号	式	MS
1275		519(M+H)
1276		427(M+H)
1277		456(M+H)
1278		516(M+H)

表122

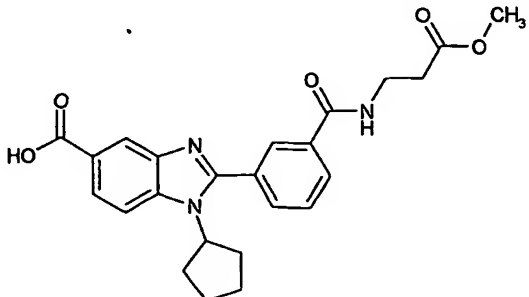
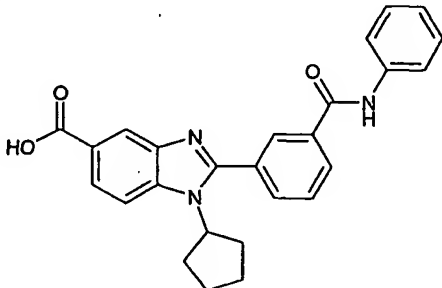
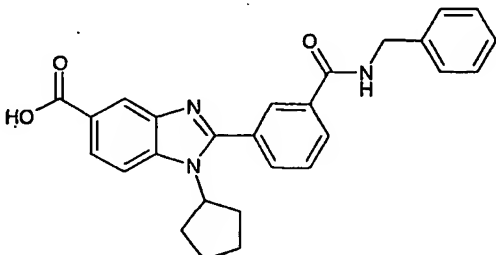
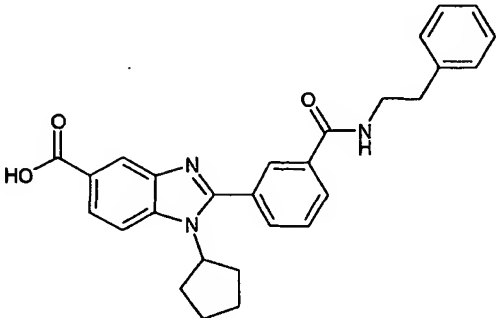
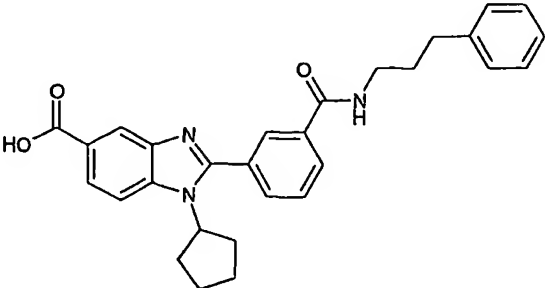
实施例 番号	式	MS
1279		436(M+H)
1280		426(M+H)
1281		440(M+H)
1282		454(M+H)
1283		468(M+H)

表123

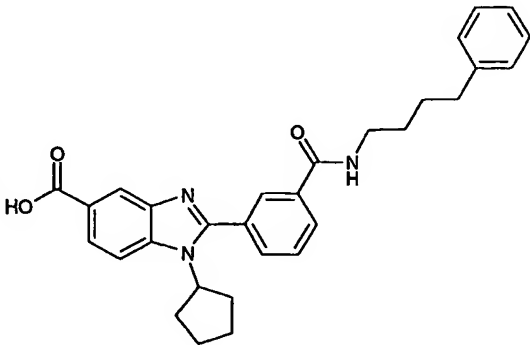
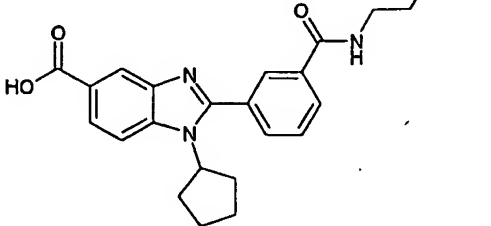
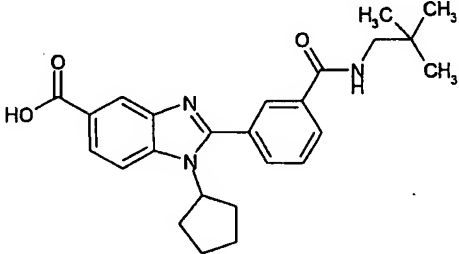
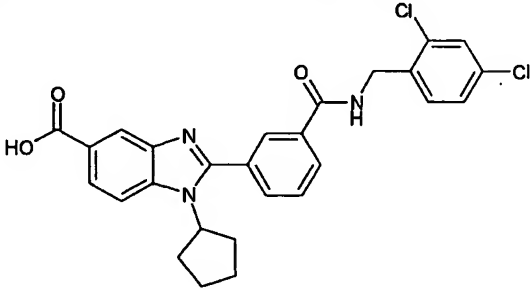
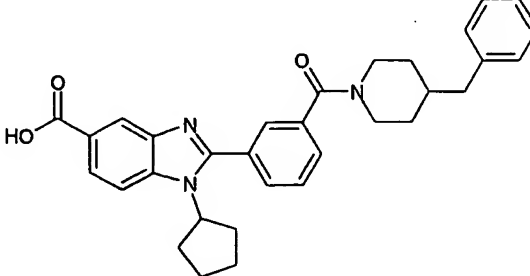
実施例 番号	式	MS
1284		482(M+H)
1285		406(M+H)
1286		420(M+H)
1287		508(M+H)
1288		508(M+H)

表124

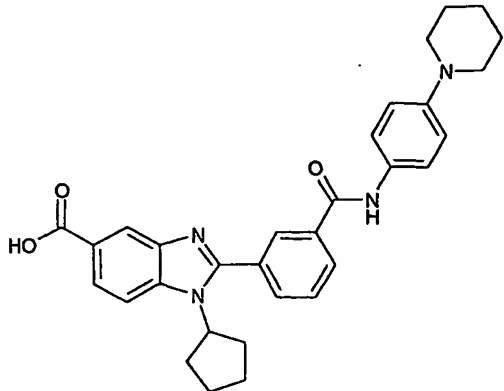
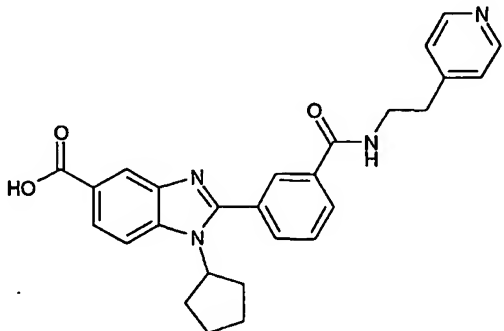
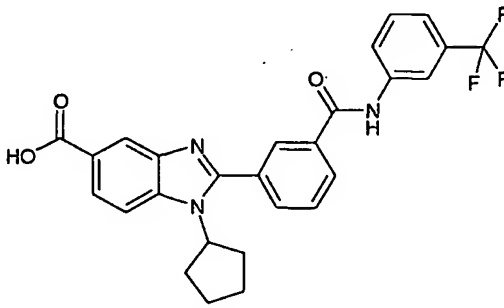
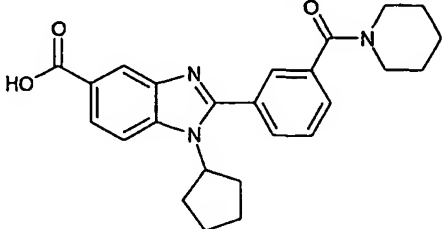
実施例 番号	式	MS
1289		509(M+H)
1290		455(M+H)
1291		494(M+H)
1292		418(M+H)

表125

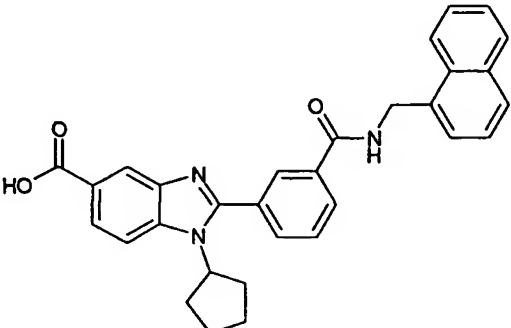
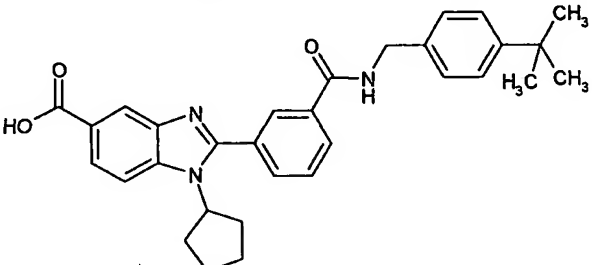
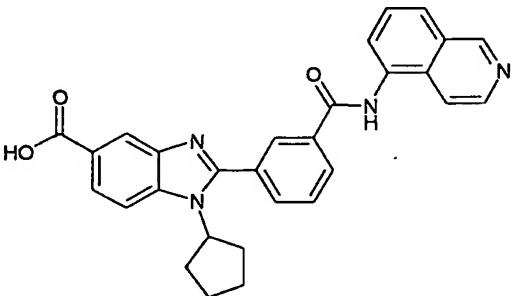
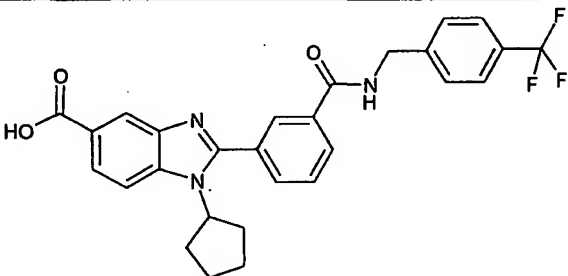
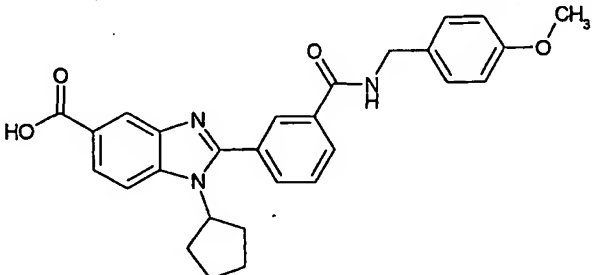
実施例 番号	式	MS
1293		490(M+H)
1294		496(M+H)
1295		477(M+H)
1296		508(M+H)
1297		470(M+H)

表126

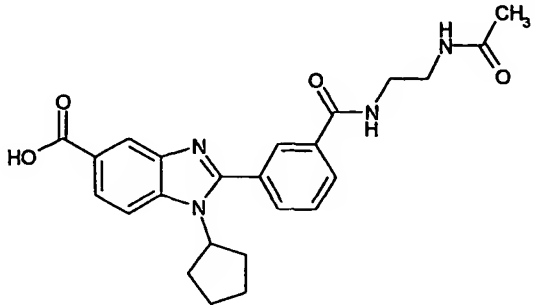
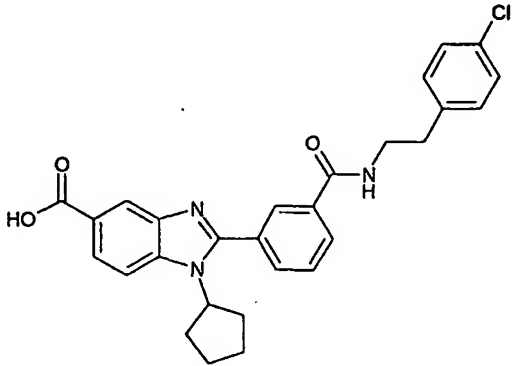
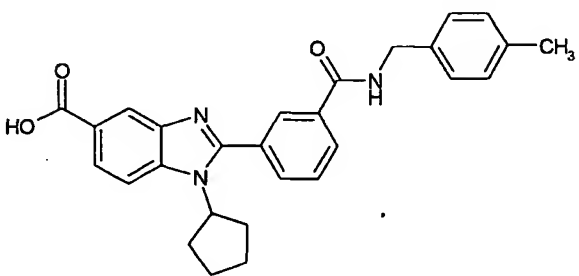
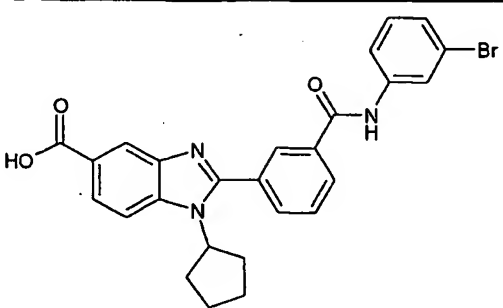
実施例 番号	式	MS
1298		435(M+H)
1299		488(M+H)
1300		454(M+H)
1301		504(M+H)



表127

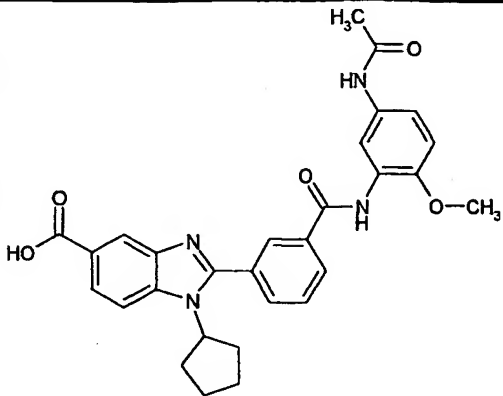
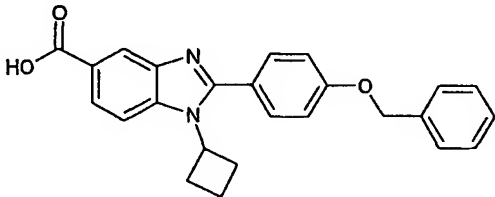
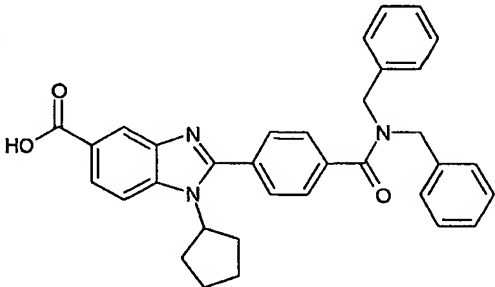
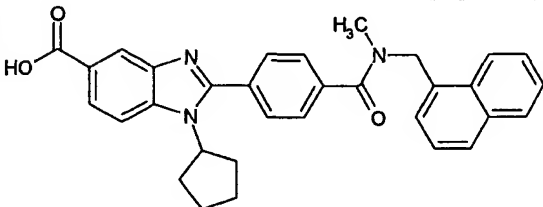
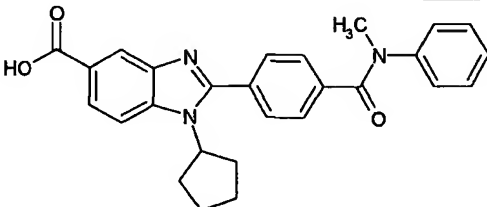
実施例 番号	式	MS
1302		513(M+H)
1303		399(M+H)
1304		530(M+H)
1305		504(M+H)
1306		440(M+H)

表128

实施例 番号	式	MS
1307		494(M+H)
1308		508(M+H)
1309		518(M+H)
1310		532(M+H)
1311		522(M+H)

表129

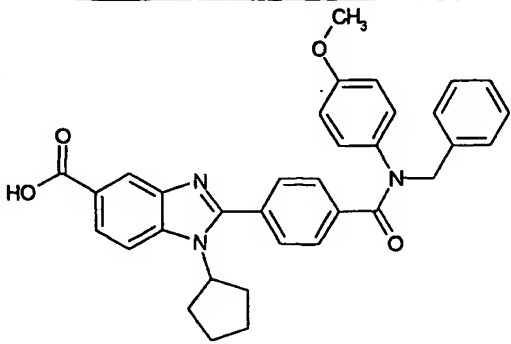
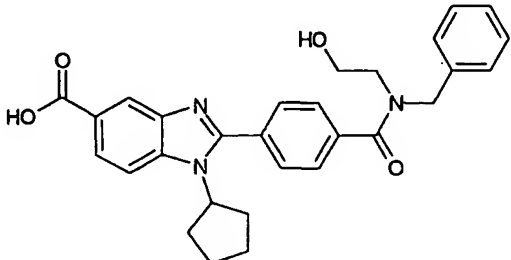
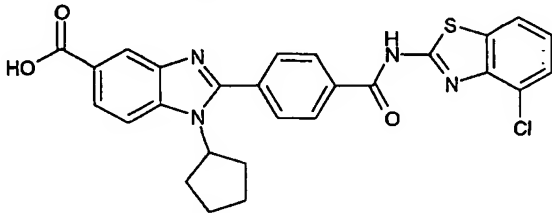
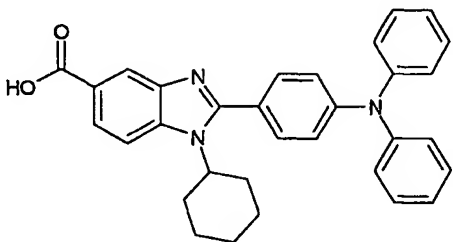
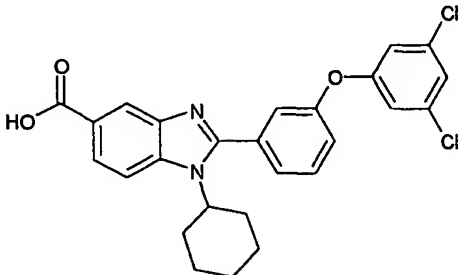
实施例 番号	式	MS
1312		546(M+H)
1313		484(M+H)
1314		517(M+H)
1315		488(M+H)
1316		481(M+H)

表130

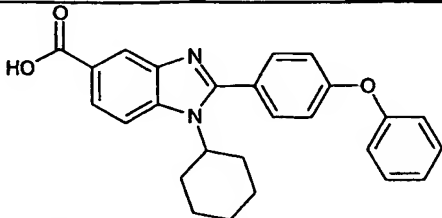
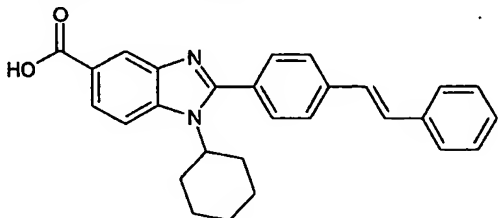
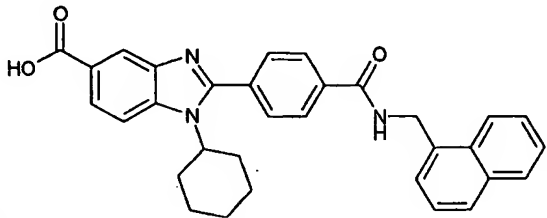
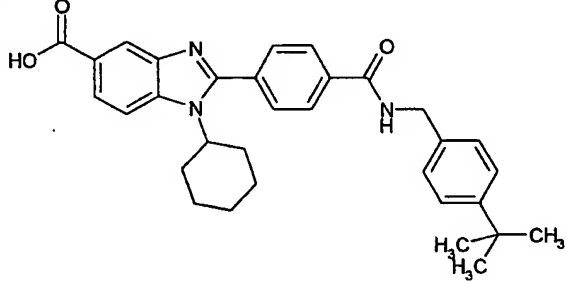
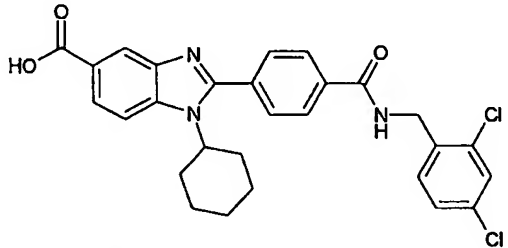
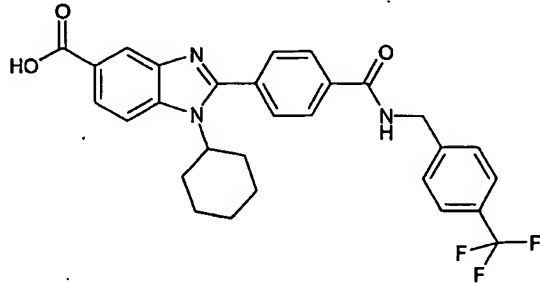
実施例 番号	式	MS
1317		413(M+H)
1318		423(M+H)
1319		504(M+H)
1320		510(M+H)
1321		522(M+H)
1322		522(M+H)

表131

実施例 番号	式	MS
1323		484(M+H)
1324		449(M+H)
1325		502(M+H)
1326		491(M+H)
1327		496(M+H)

表132

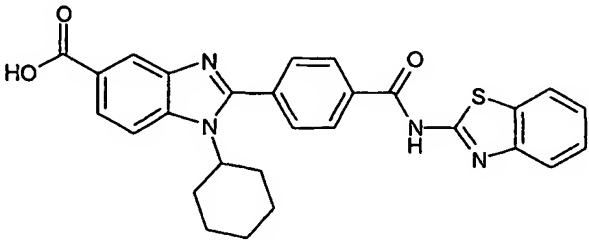
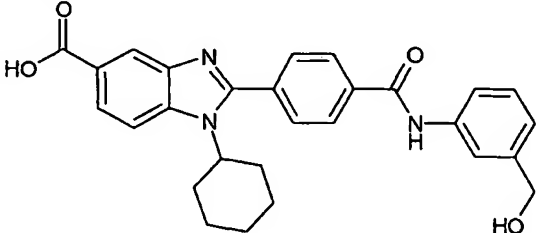
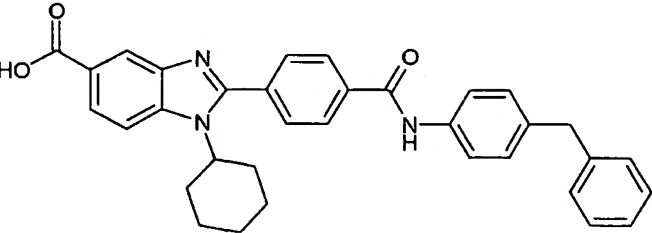
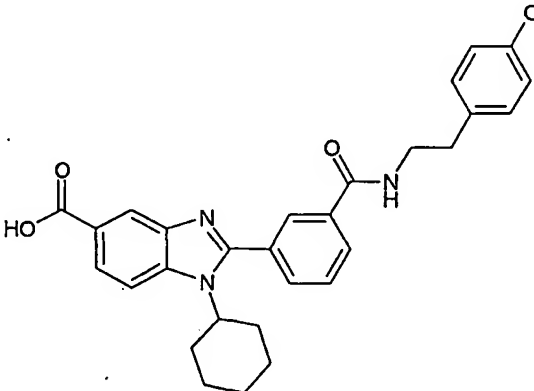
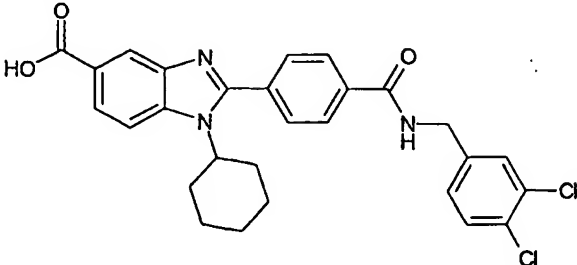
実施例 番号	式	MS
1328		497(M+H)
1329		470(M+H)
1330		530(M+H)
1331		502(M+H)
1332		522(M+H)

表133

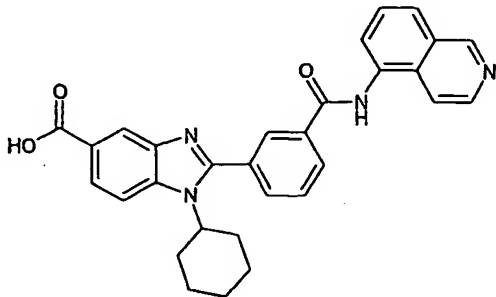
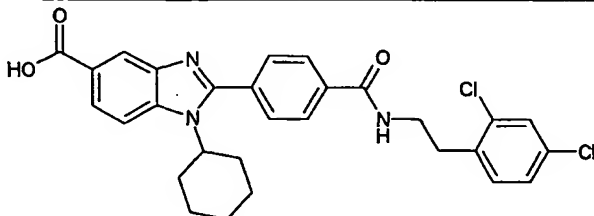
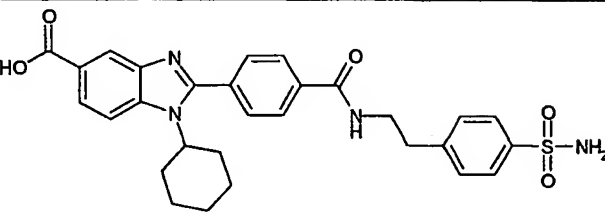
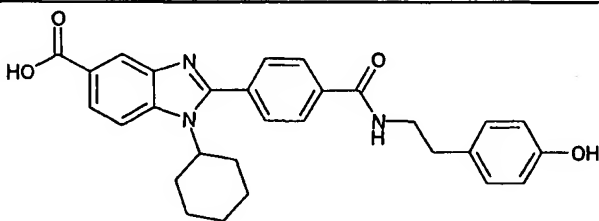
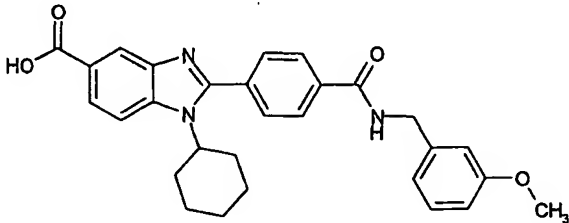
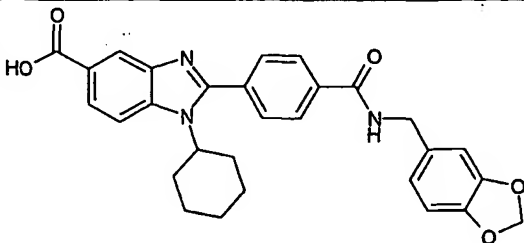
実施例 番号	式	MS
1333		491(M+H)
1334		536(M+H)
1335		547(M+H)
1336		484(M+H)
1337		484(M+H)
1338		498(M+H)

表134

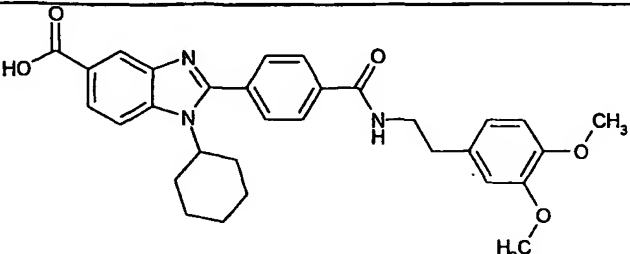
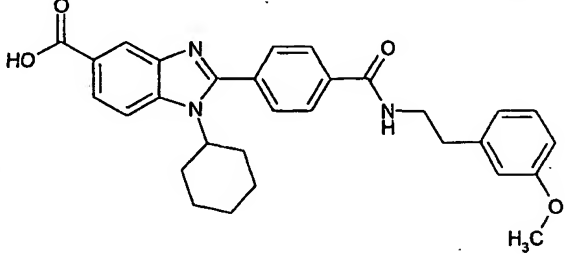
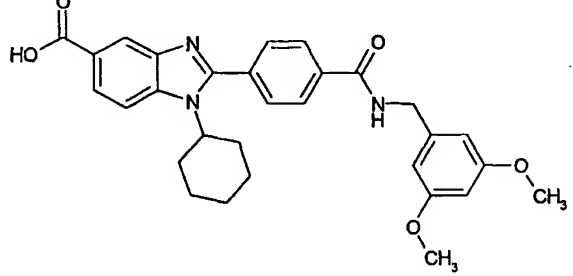
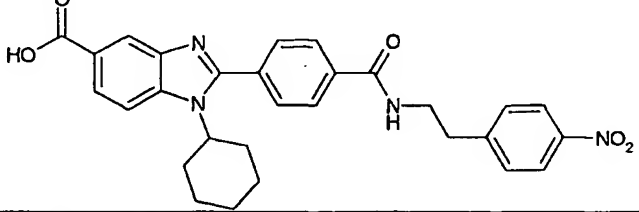
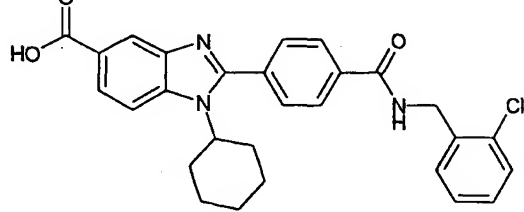
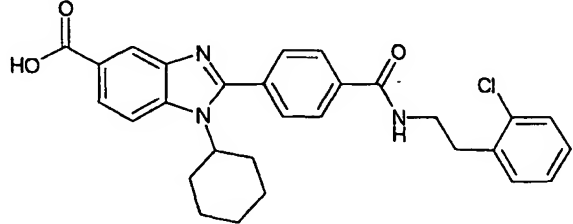
実施例 番号	式	MS
1339		528(M+H)
1340		498(M+H)
1341		514(M+H)
1342		513(M+H)
1343		488(M+H)
1344		502(M+H)



表135

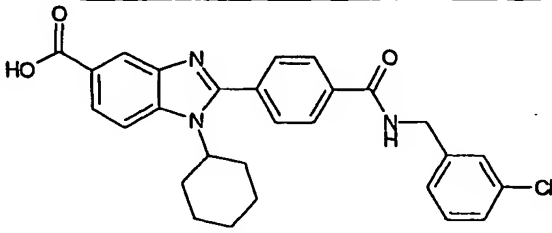
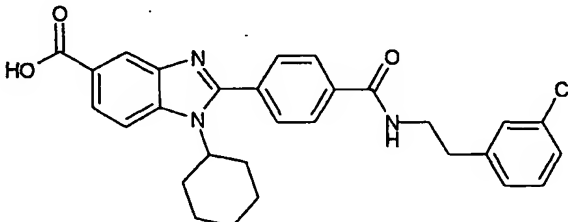
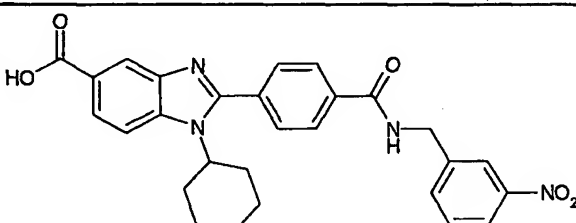
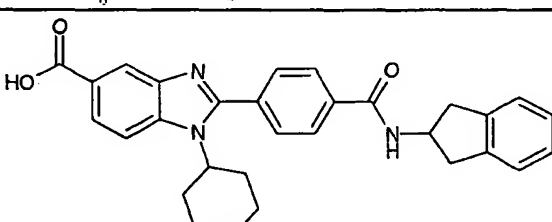
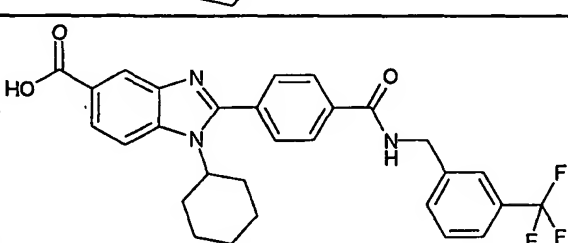
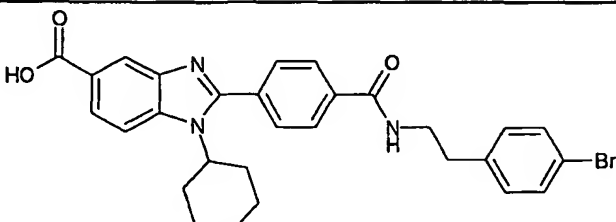
実施例 番号	式	MS
1345		488(M+H)
1346		502(M+H)
1347		499(M+H)
1348		480(M+H)
1349		522(M+H)
1350		546(M+H)

表136

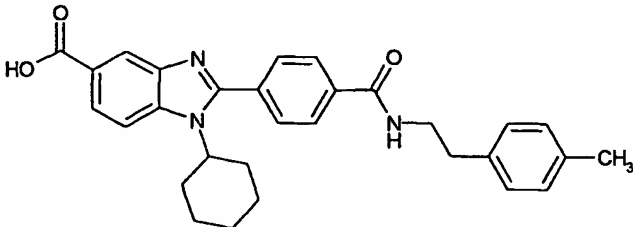
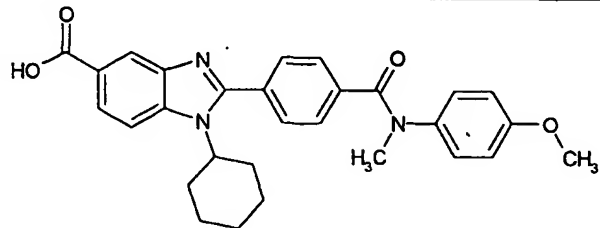
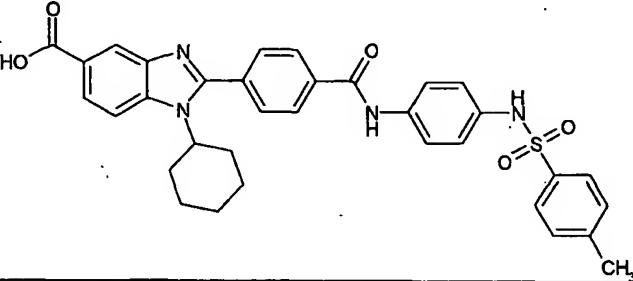
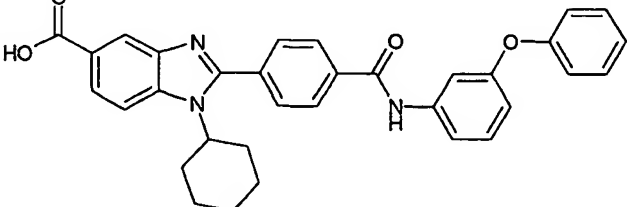
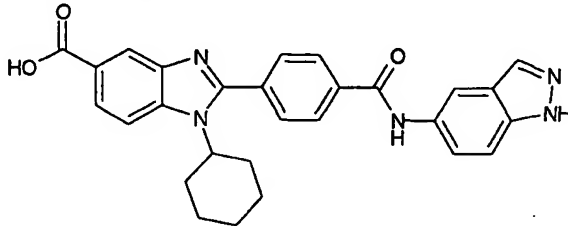
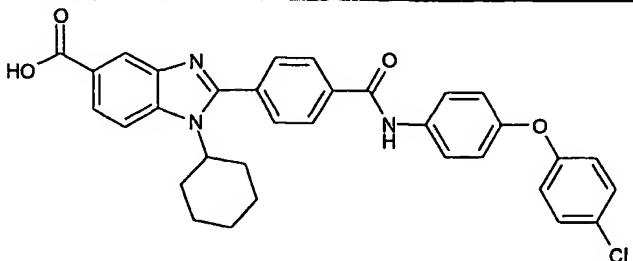
实施例 番号	式	MS
1351		482(M+H)
1352		484(M+H)
1353		609(M+H)
1354		532(M+H)
1355		480(M+H)
1356		566(M+H)

表137

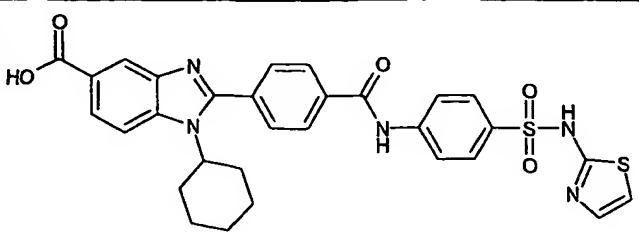
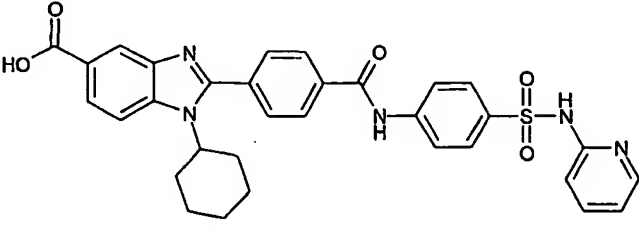
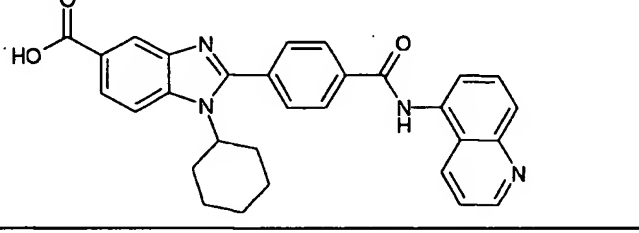
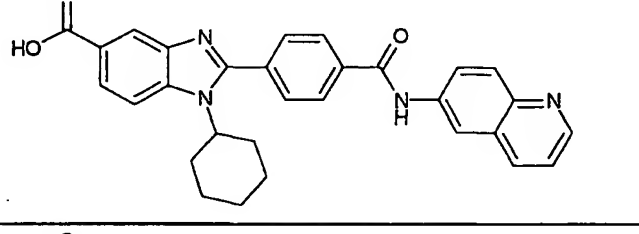
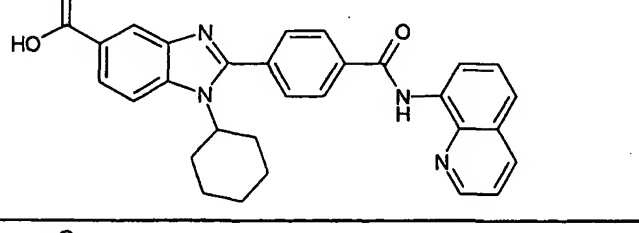
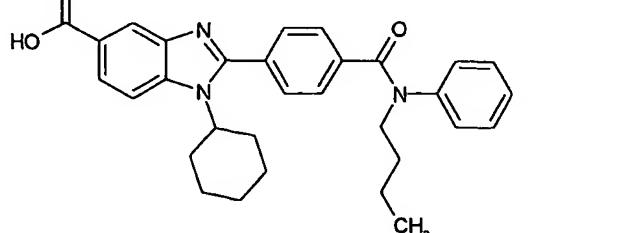
実施例 番号	式	MS
1357		602(M+H)
1358		596(M+H)
1359		491(M+H)
1360		491(M+H)
1361		491(M+H)
1362		496(M+H)

表138

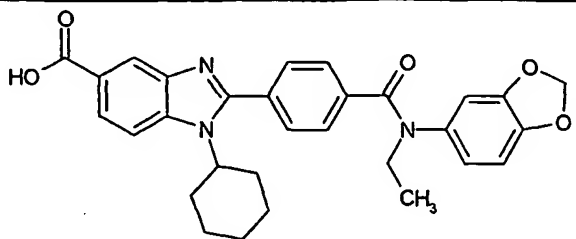
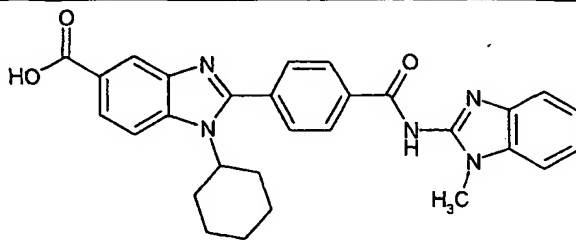
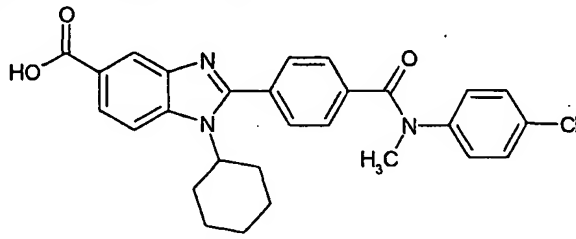
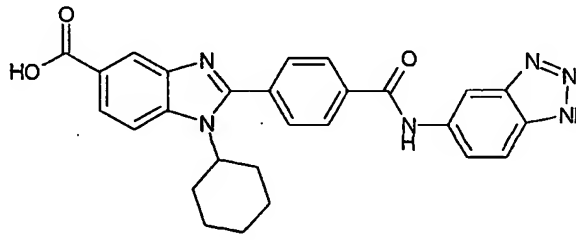
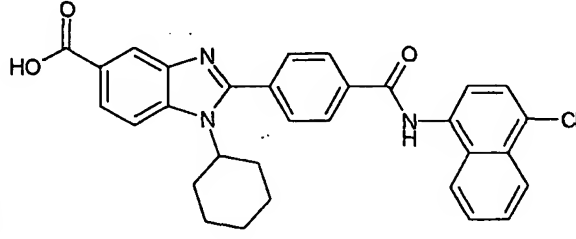
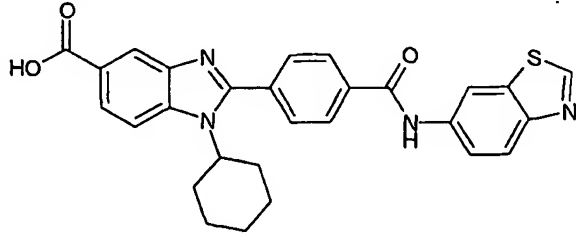
実施例 番号	式	MS
1363		512(M+H)
1364		494(M+H)
1365		488(M+H)
1366		481(M+H)
1367		524(M+H)
1368		497(M+H)

表139

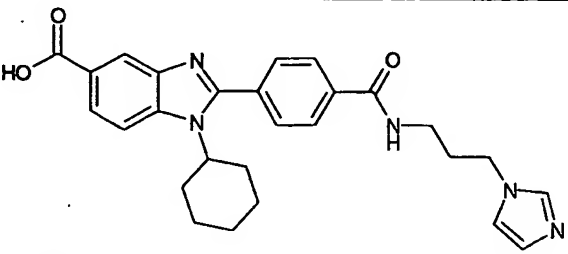
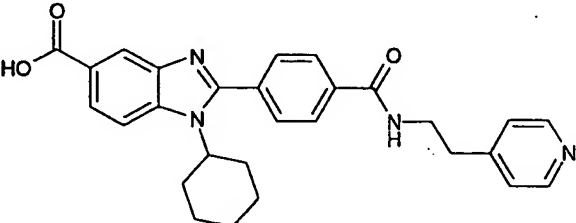
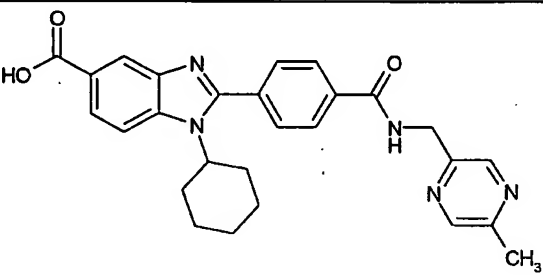
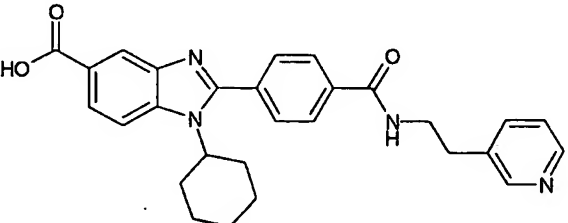
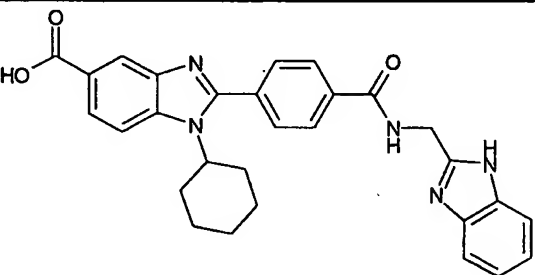
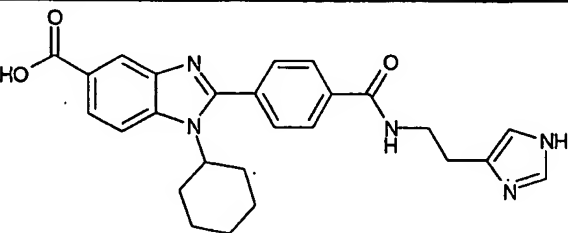
実施例 番号	式	MS
1369		472(M+H)
1370		469(M+H)
1371		470(M+H)
1372		469(M+H)
1373		494(M+H)
1374		458(M+H)

表140

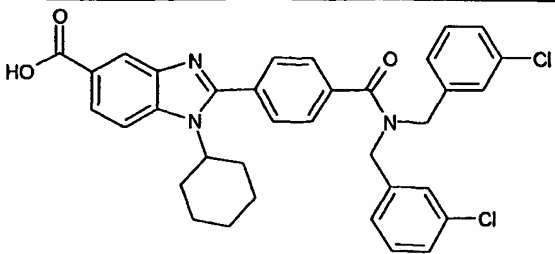
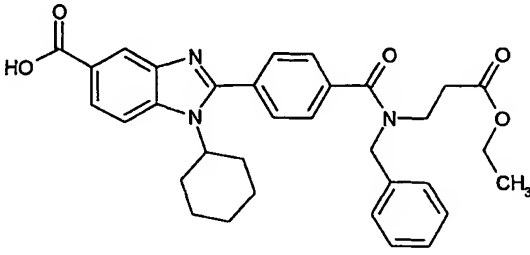
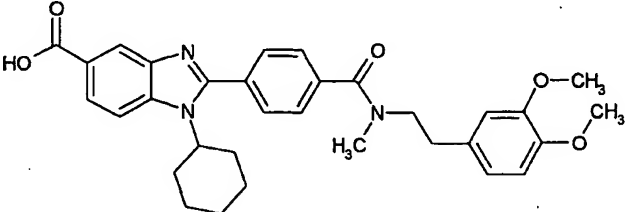
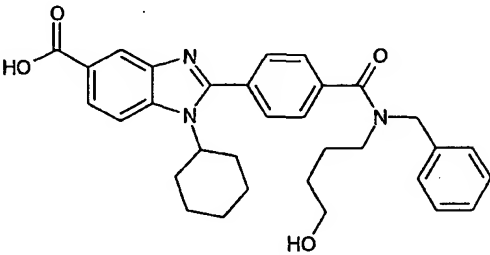
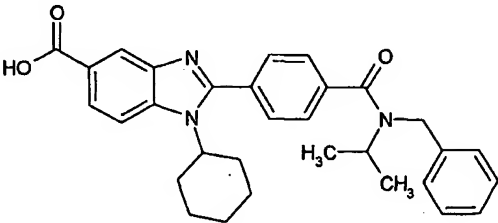
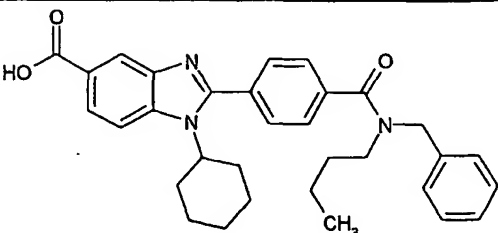
実施例 番号	式	MS
1375		612(M+H)
1376		554(M+H)
1377		542(M+H)
1378		526(M+H)
1379		496(M+H)
1380		510(M+H)

表141

実施例 番号	式	MS
1381		540(M+H)
1382		525(M+H)
1383		558(M+H)
1384		523(M+H)
1385		539(M+H)

表142

实施例 番号	式	MS
1386		533(M+H)
1387		500(M+H)
1388		485(M+H)
1389		523(M+H)
1390		512(M+H)



表143

实施例 番号	式	MS
1391		540(M+H)
1392		527(M+H)
1393		525(M+H)
1394		507(M+H)
1395		491(M+H)
1396		506(M+H)

表144

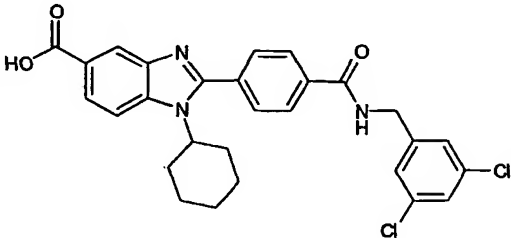
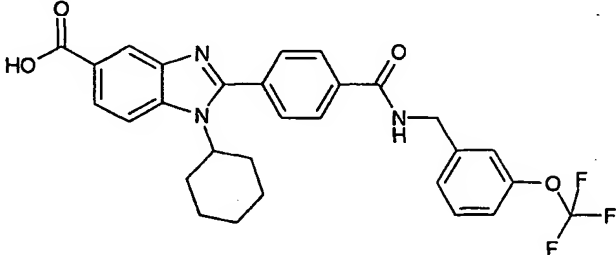
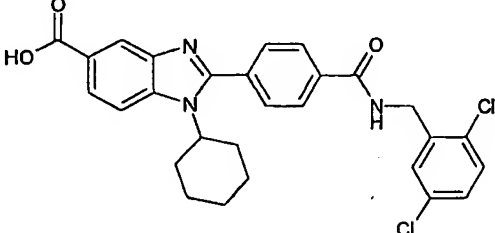
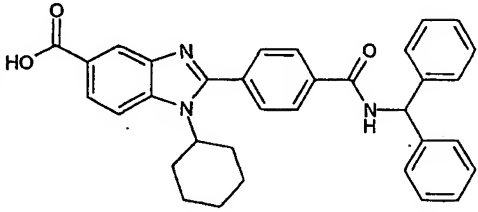
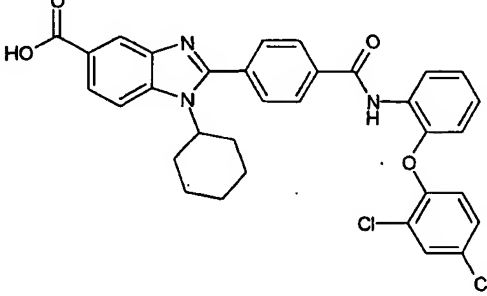
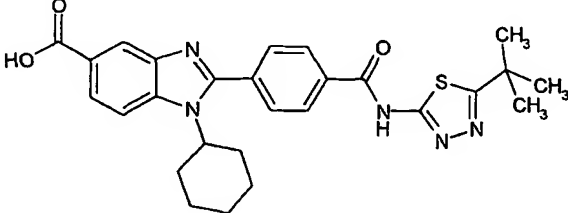
実施例 番号	式	MS
1397		522(M+H)
1398		538(M+H)
1399		522(M+H)
1400		530(M+H)
1401		600(M+H)
1402		504(M+H)

表145

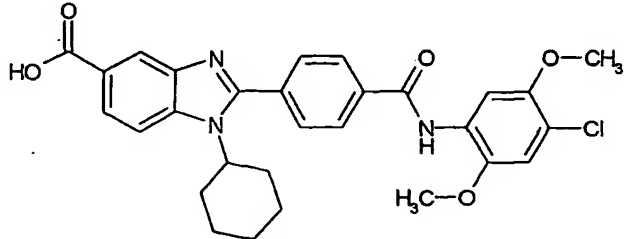
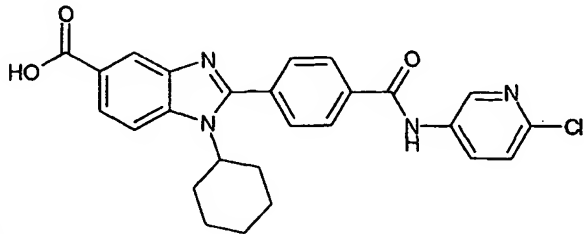
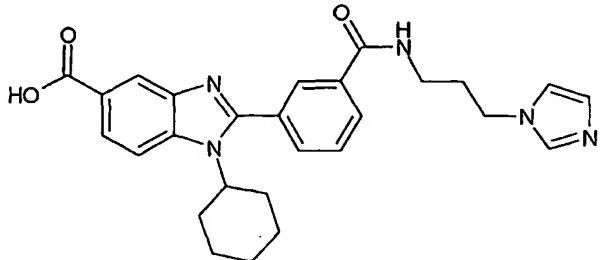
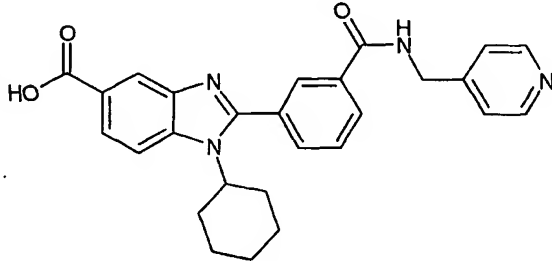
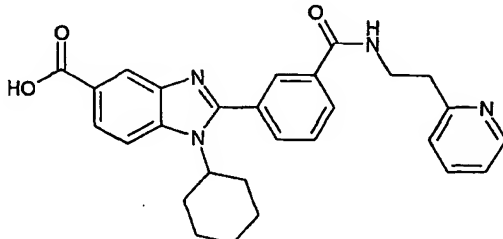
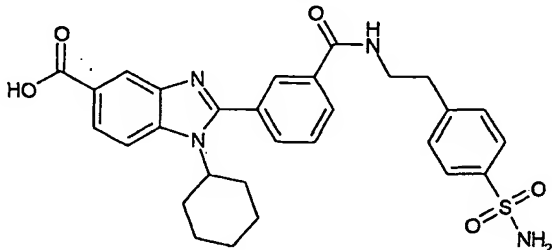
実施例 番号	式	MS
1403		534(M+H)
1404		475(M+H)
1405		472(M+H)
1406		455(M+H)
1407		469(M+H)
1408		547(M+H)

表146

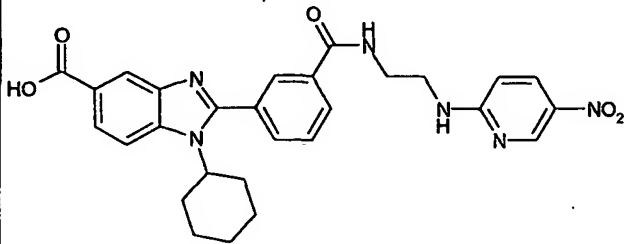
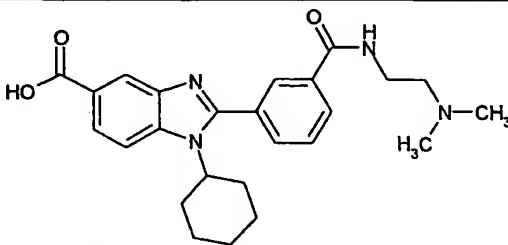
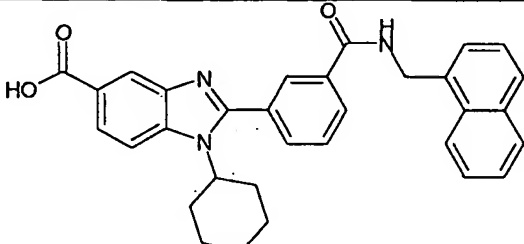
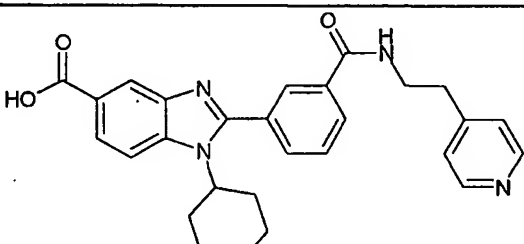
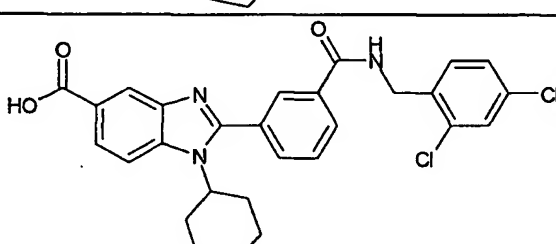
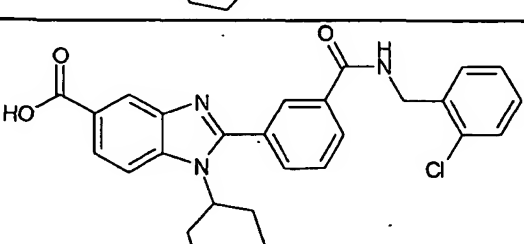
実施例 番号	式	MS
1409		529(M+H)
1410		435(M+H)
1411		504(M+H)
1412		469(M+H)
1413		522(M+H)
1414		488(M+H)

表147

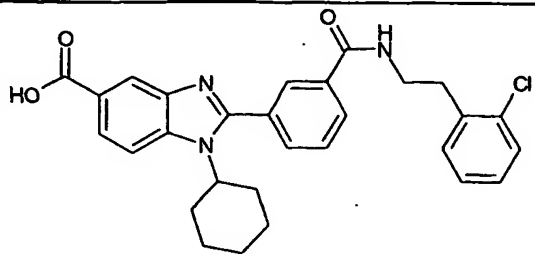
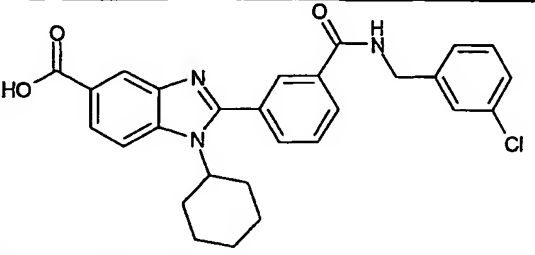
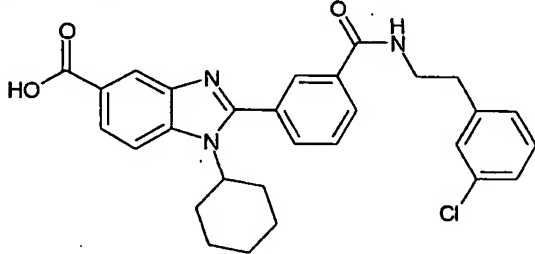
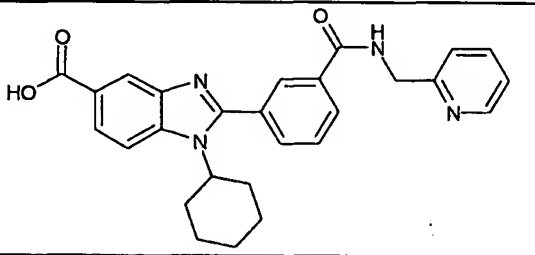
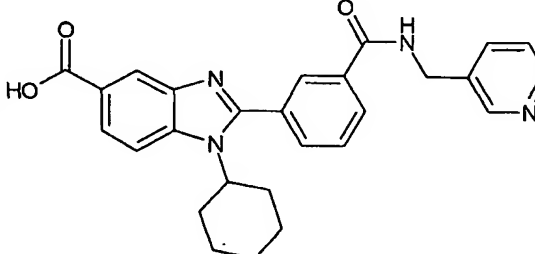
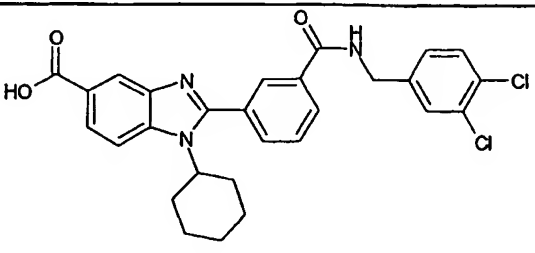
実施例 番号	式	MS
1415		502(M+H)
1416		488(M+H)
1417		502(M+H)
1418		455(M+H)
1419		455(M+H)
1420		522(M+H)

表148

实施例 番号	式	MS
1421		469(M+H)
1422		536(M+H)
1423		510(M+H)
1424		494(M+H)
1425		458(M+H)

表149

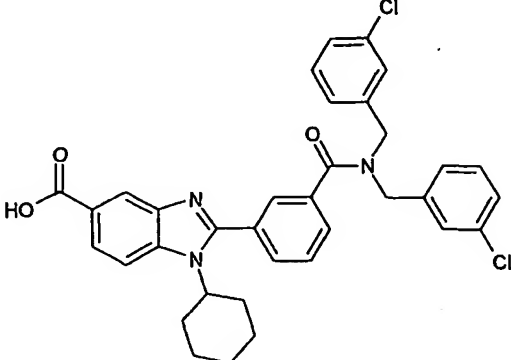
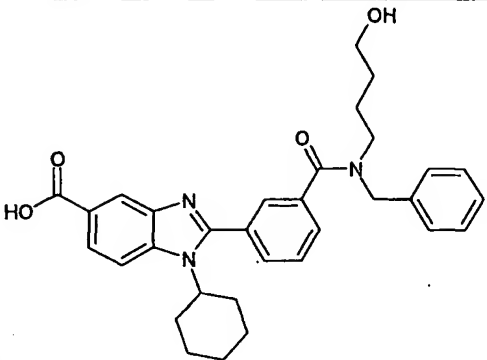
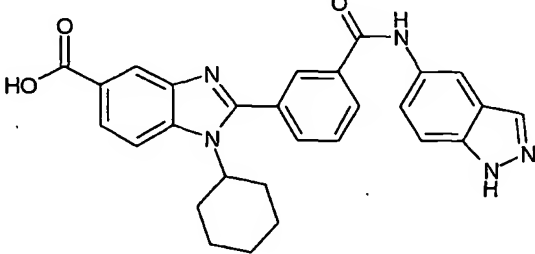
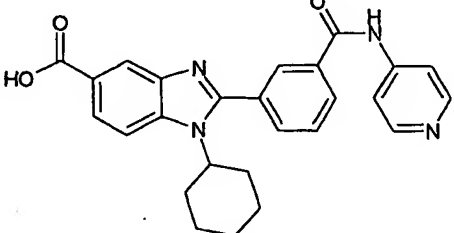
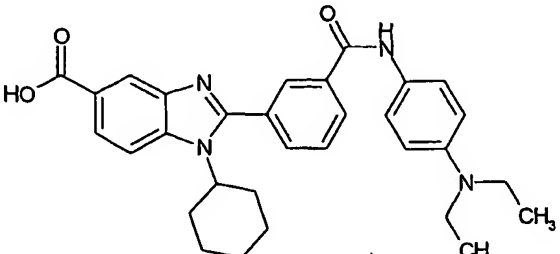
実施例 番号	式	MS
1426		612(M+H)
1427		526(M+H)
1428		480(M+H)
1429		441(M+H)
1430		511(M+H)

表150

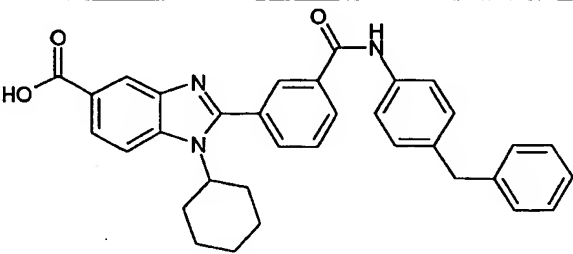
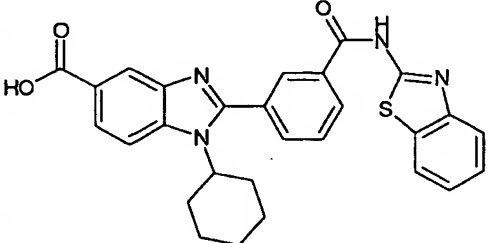
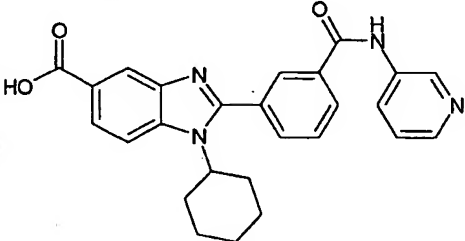
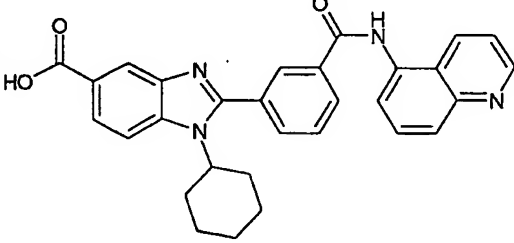
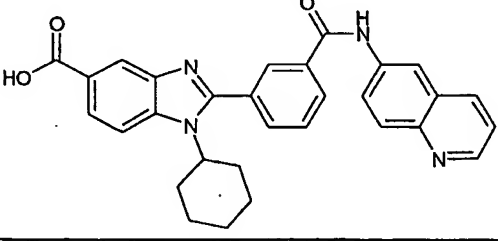
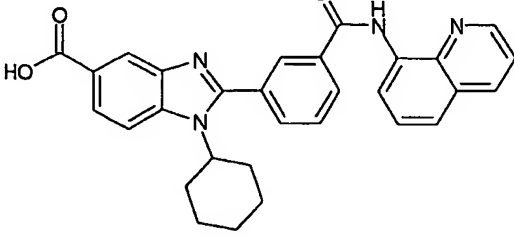
実施例 番号	式	MS
1431		530(M+H)
1432		497(M+H)
1433		441(M+H)
1434		491(M+H)
1435		491(M+H)
1436		491(M+H)



表151

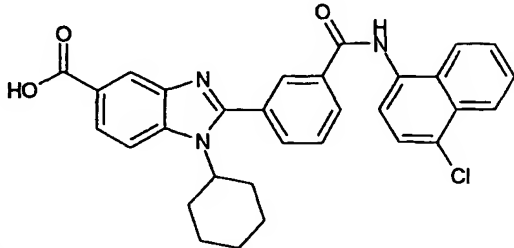
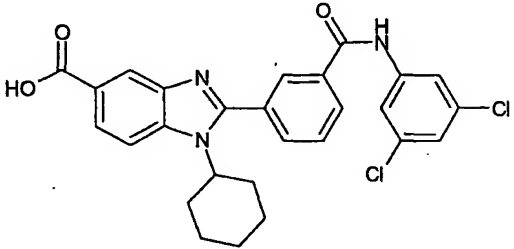
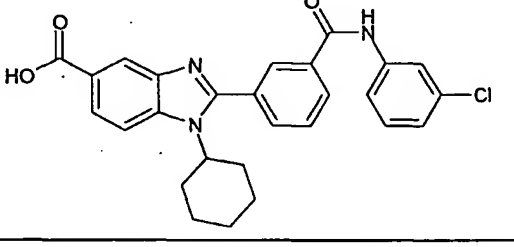
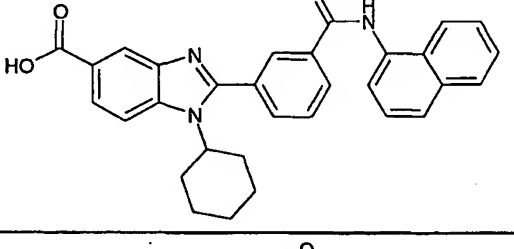
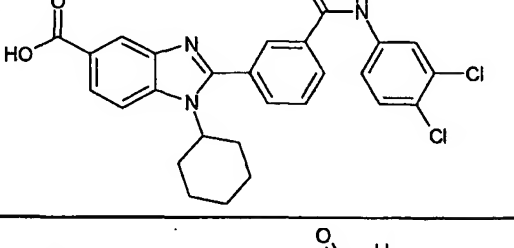
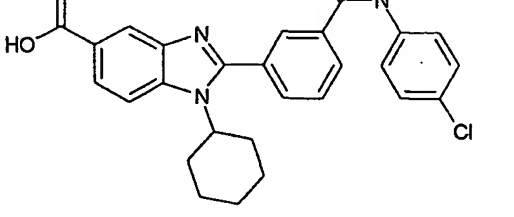
実施例 番号	式	MS
1437		524(M+H)
1438		508(M+H)
1439		474(M+H)
1440		490(M+H)
1441		508(M+H)
1442		474(M+H)

表152

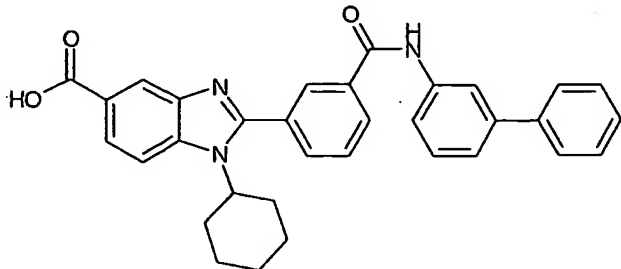
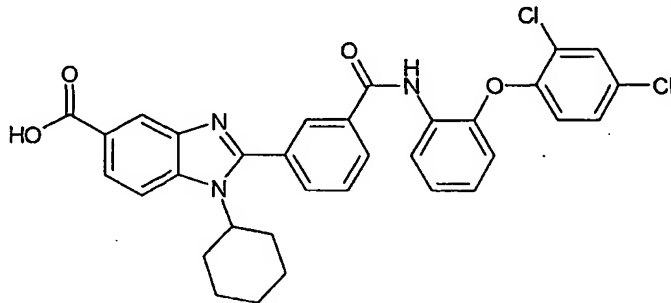
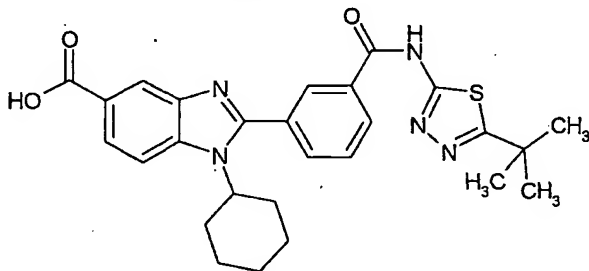
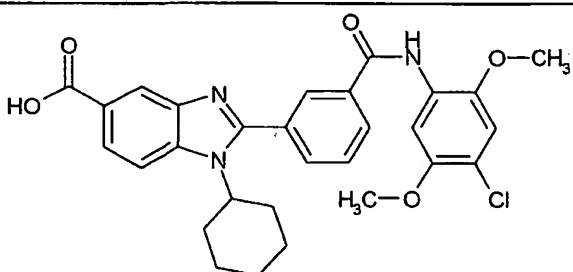
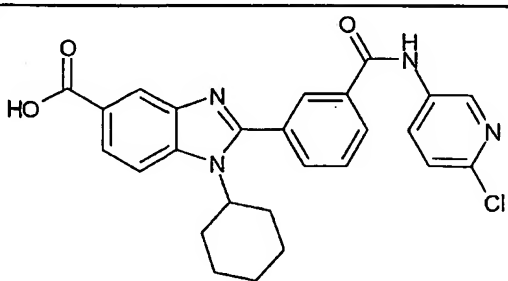
实施例 番号	式	MS
1443		516(M+H)
1444		600(M+H)
1445		504(M+H)
1446		534(M+H)
1447		475(M+H)

表153

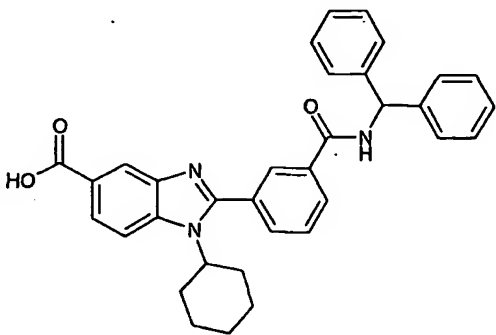
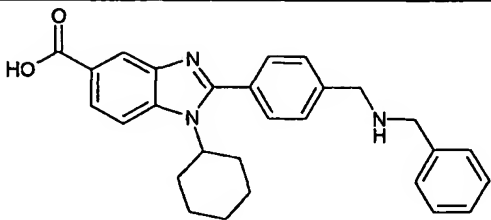
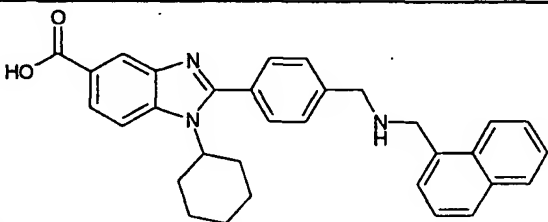
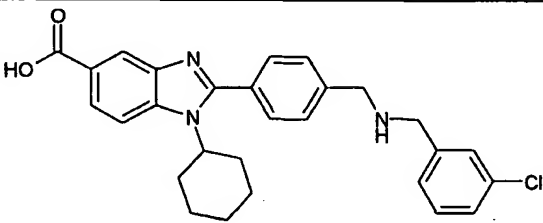
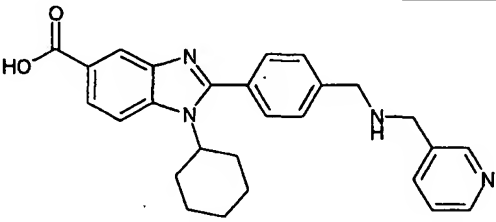
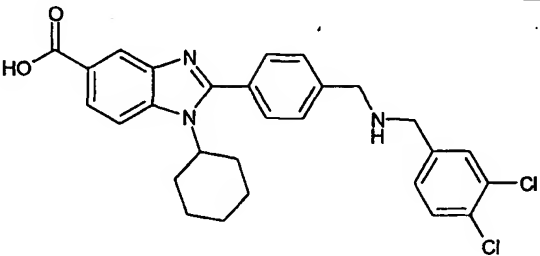
実施例 番号	式	MS
1448		530(M+H)
1449		440(M+H)
1450		490(M+H)
1451		474(M+H)
1452		441(M+H)
1453		508(M+H)

表154

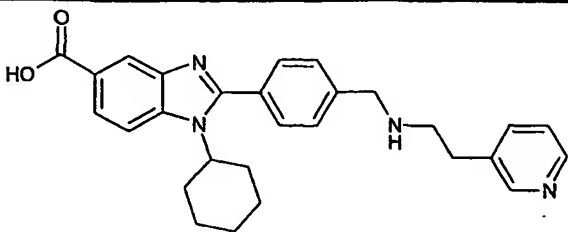
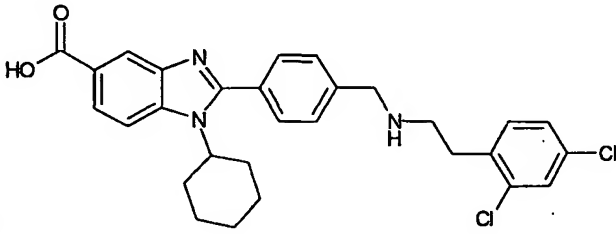
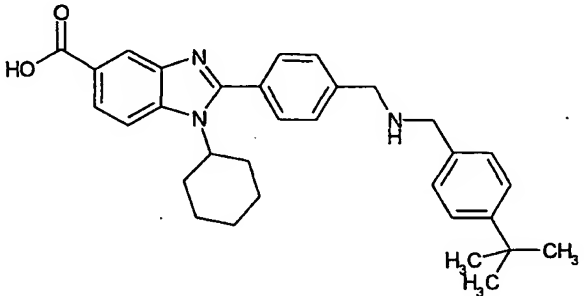
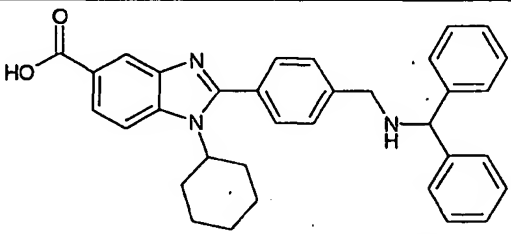
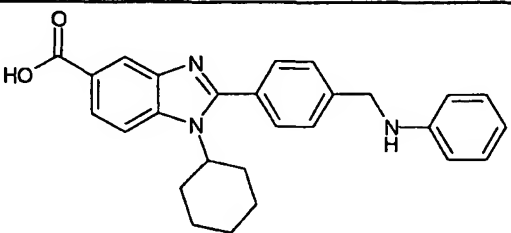
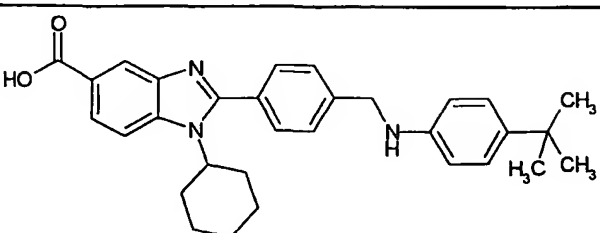
実施例 番号	式	MS
1454		455(M+H)
1455		522(M+H)
1456		496(M+H)
1457		516(M+H)
1458		426(M+H)
1459		482(M+H)

表155

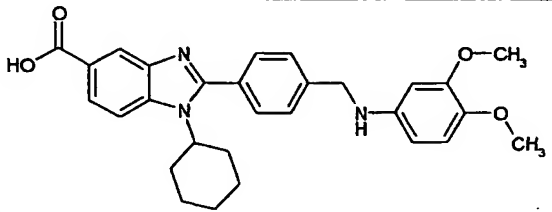
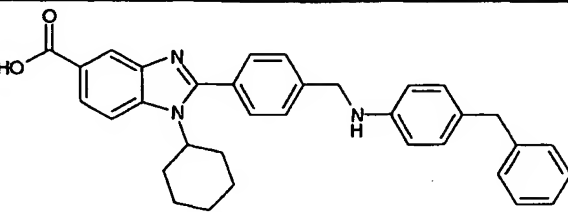
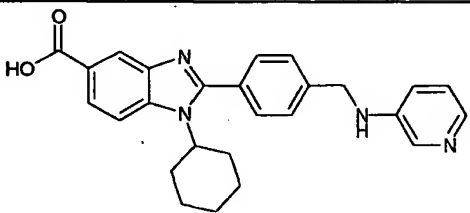
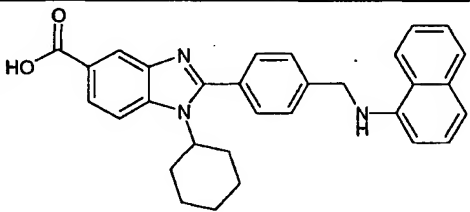
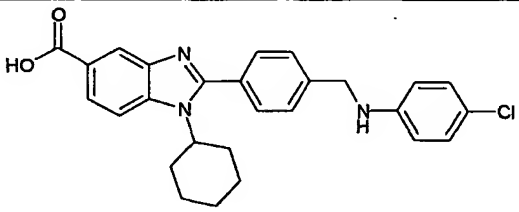
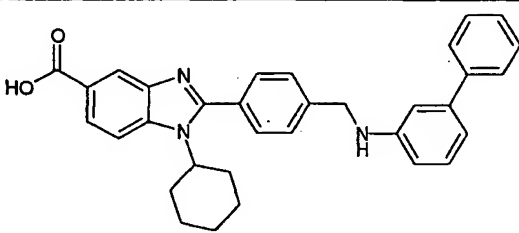
実施例 番号	式	MS
1460		486(M+H)
1461		516(M+H)
1462		427(M+H)
1463		476(M+H)
1464		460(M+H)
1465		502(M+H)

表156

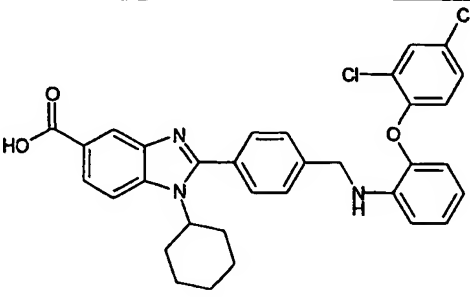
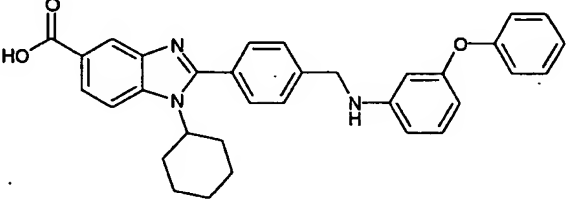
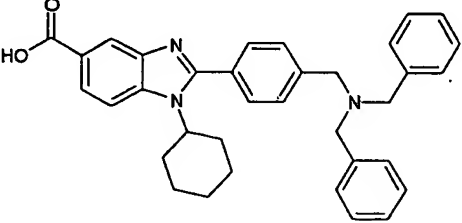
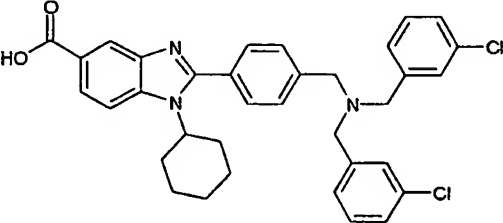
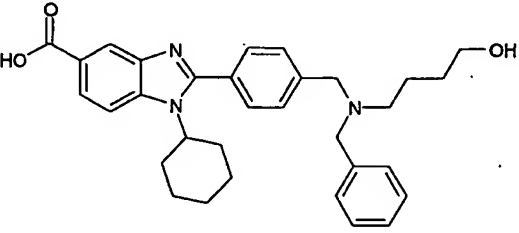
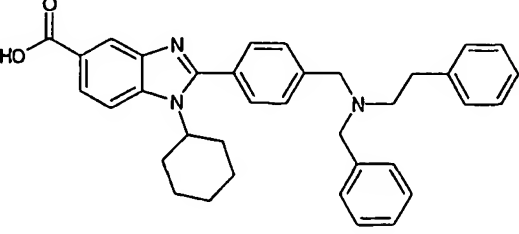
実施例 番号	式	MS
1466		586(M+H)
1467		518(M+H)
1468		530(M+H)
1469		598(M+H)
1470		512(M+H)
1471		544(M+H)

表157

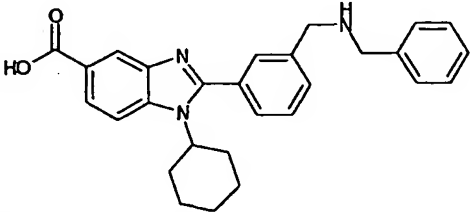
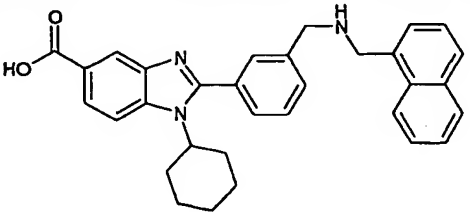
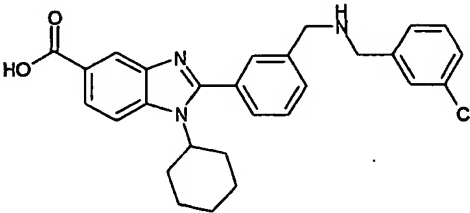
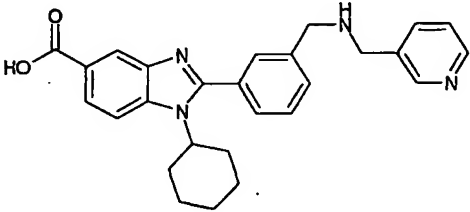
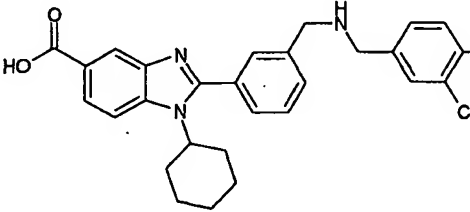
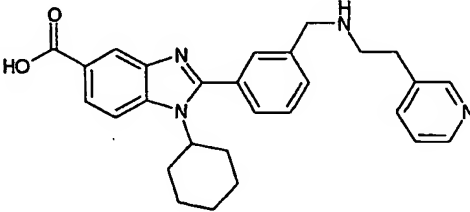
実施例 番号	式	MS
1472		440(M+H)
1473		490(M+H)
1474		474(M+H)
1475		441(M+H)
1476		508(M+H)
1477		455(M+H)

表158

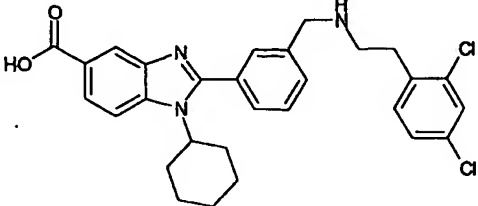
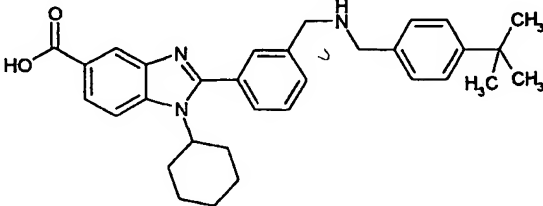
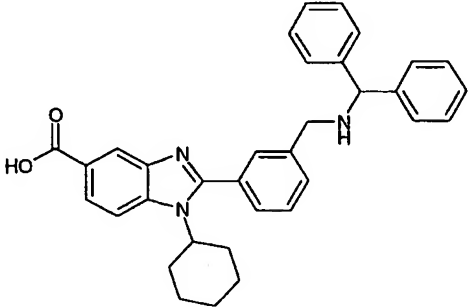
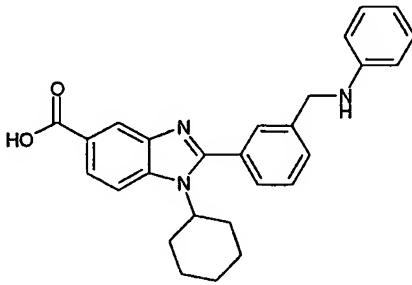
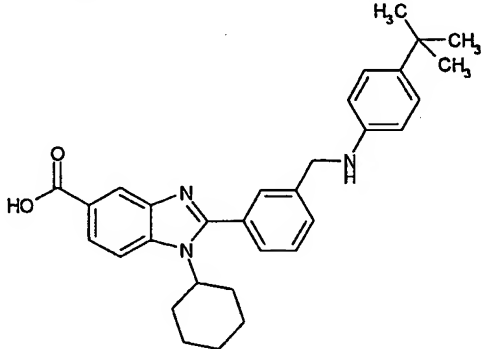
実施例 番号	式	MS
1478		522(M+H)
1479		496(M+H)
1480		516(M+H)
1481		426(M+H)
1482		482(M+H)



表159

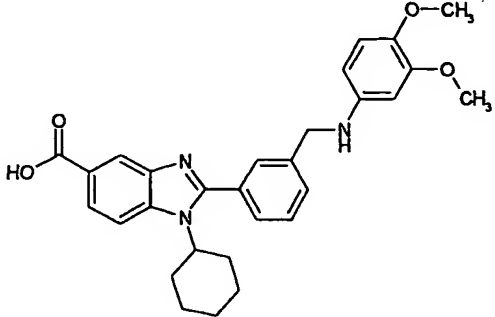
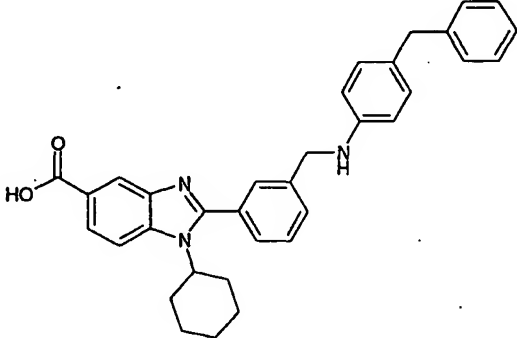
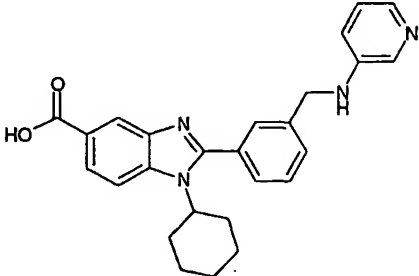
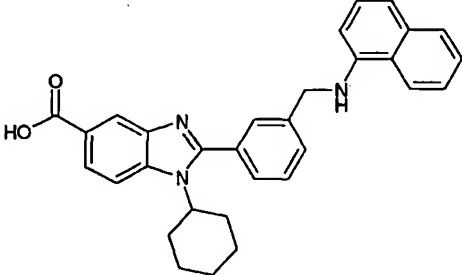
実施例 番号	式	MS
1483		486(M+H)
1484		516(M+H)
1485		427(M+H)
1486		476(M+H)

表160

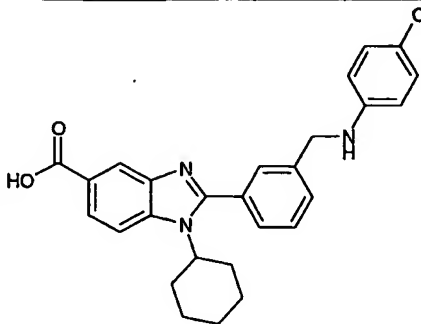
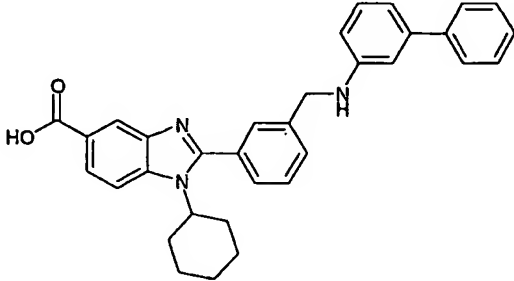
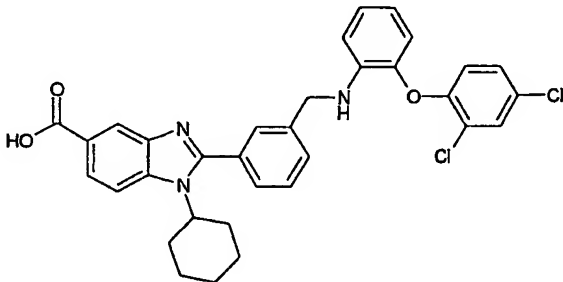
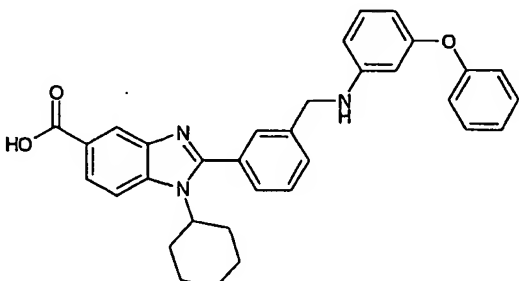
実施例 番号	式	MS
1487		460(M+H)
1488		502(M+H)
1489		586(M+H)
1490		518(M+H)

表161

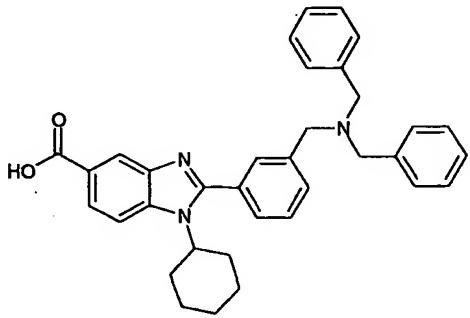
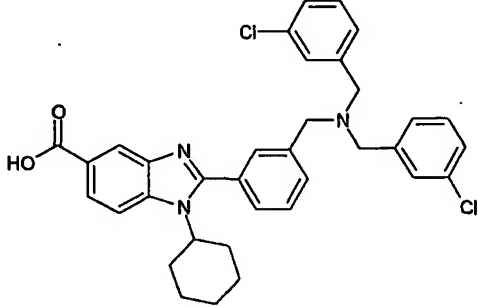
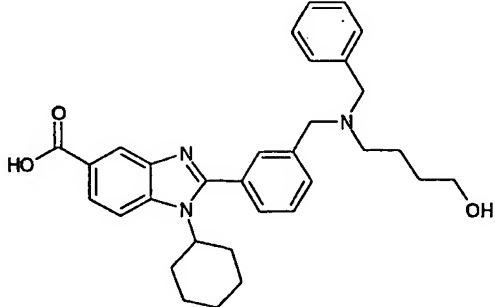
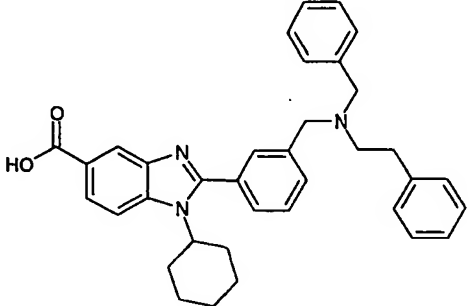
実施例 番号	式	MS
1491		530(M+H)
1492		598(M+H)
1493		512(M+H)
1494		544(M+H)

表162

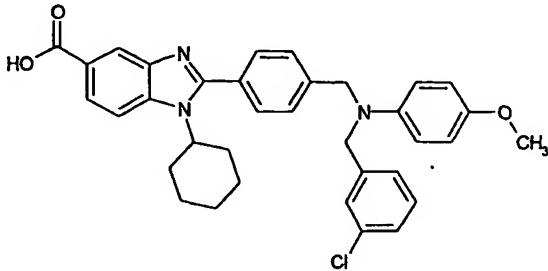
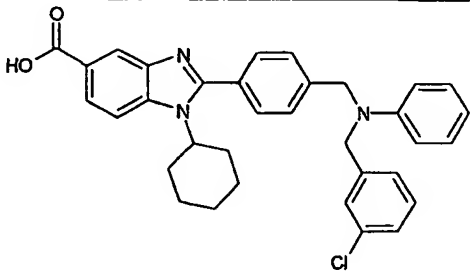
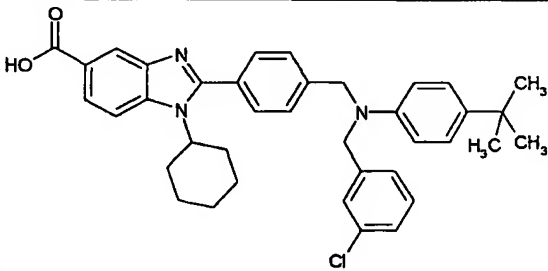
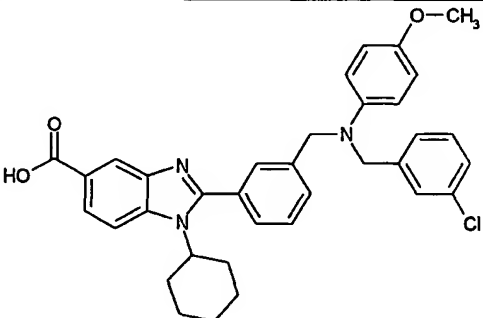
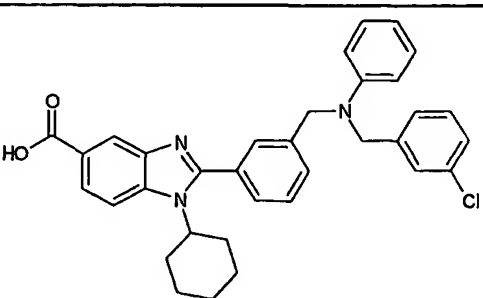
実施例 番号	式	MS
1495		580(M+H)
1496		550(M+H)
1497		606(M+H)
1498		580(M+H)
1499		550(M+H)

表163

実施例 番号	式	MS
1500		606(M+H)
1501		630(M+H)
1502		600(M+H)
1503		656(M+H)

表164

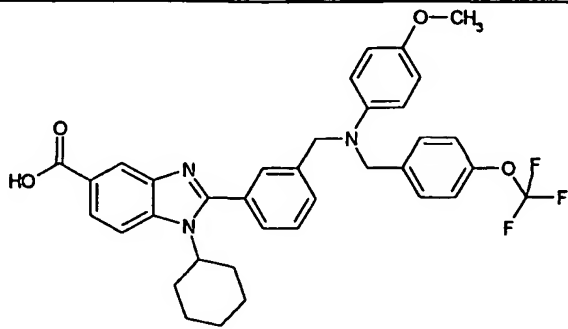
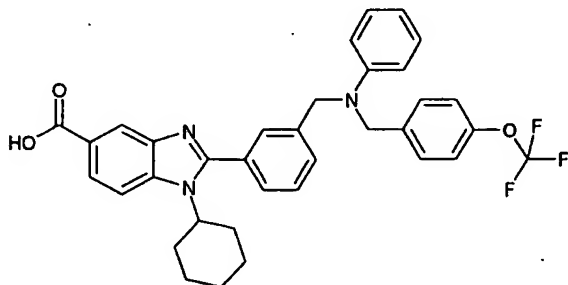
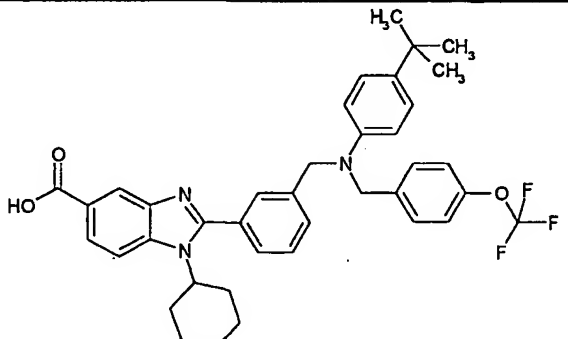
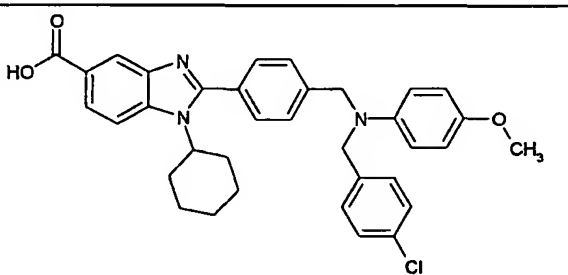
实施例 番号	式	MS
1504		630(M+H)
1505		600(M+H)
1506		656(M+H)
1507		580(M+H)

表165

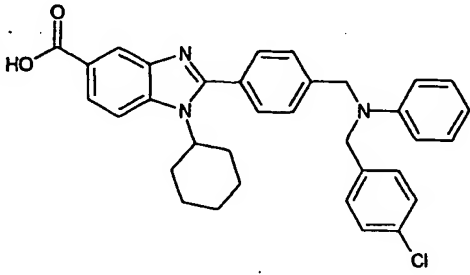
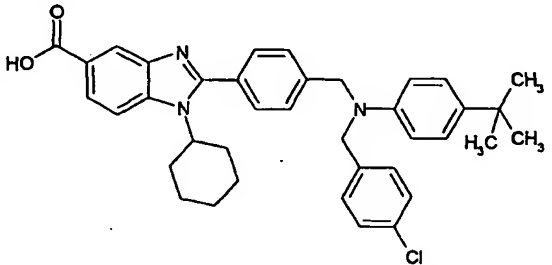
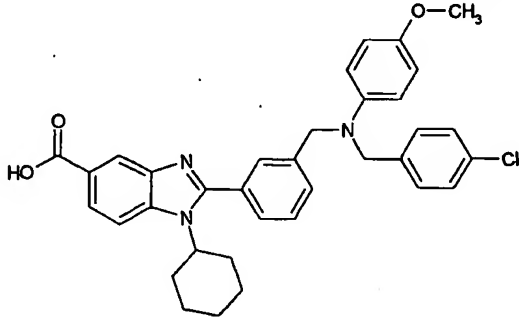
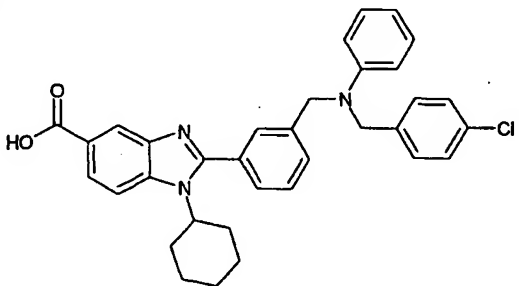
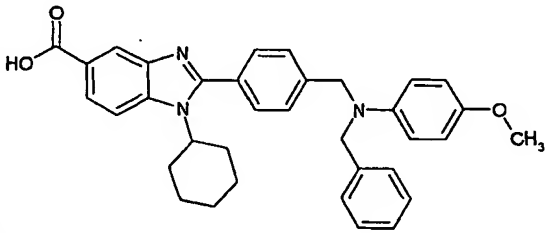
実施例 番号	式	MS
1508		550(M+H)
1509		606(M+H)
1510		580(M+H)
1511		550(M+H)
1512		546(M+H)

表166

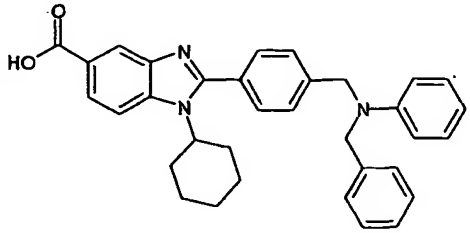
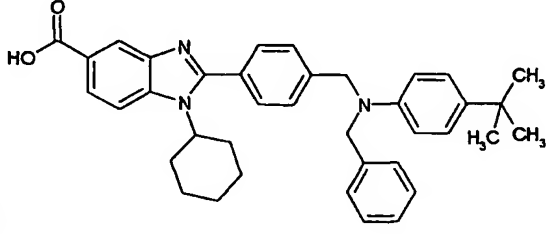
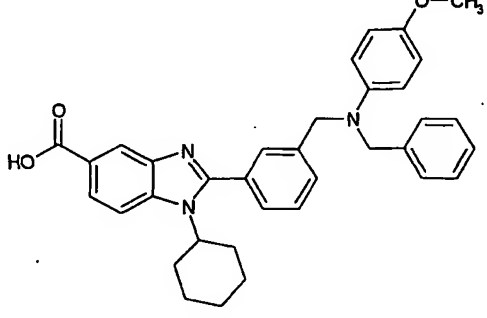
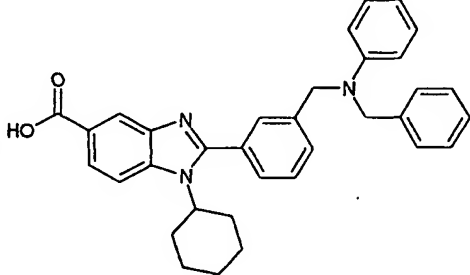
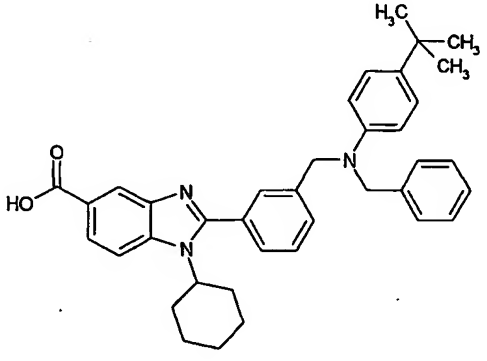
実施例 番号	式	MS
1513		516(M+H)
1514		572(M+H)
1515		546(M+H)
1516		516(M+H)
1517		572(M+H)



表167

実施例 番号	式	MS
1518	 <chem>COc1ccc(cc1)CN(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)c4nc5cc(ccc5n4C6CCCCC6)C(=O)O</chem>	602(M+H)
1519	 <chem>c1ccc(cc1)N(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)c4nc5cc(ccc5n4C6CCCCC6)C(=O)O</chem>	572(M+H)
1520	 <chem>CC(C)(C)c1ccc(cc1)N(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)c4nc5cc(ccc5n4C6CCCCC6)C(=O)O</chem>	628(M+H)
1521	 <chem>Clc1ccc(cc1)N(Cc2ccc(cc2)C(C)(C)C)c3ccc(cc3)c4nc5cc(ccc5n4C6CCCCC6)C(=O)O</chem>	606(M+H)

表168

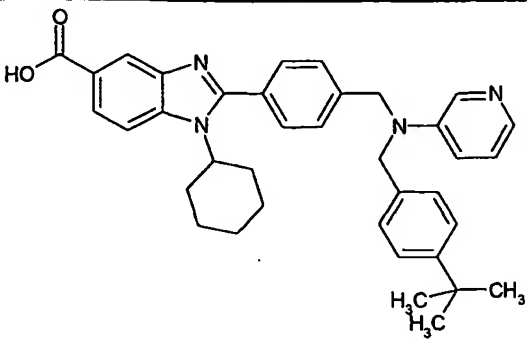
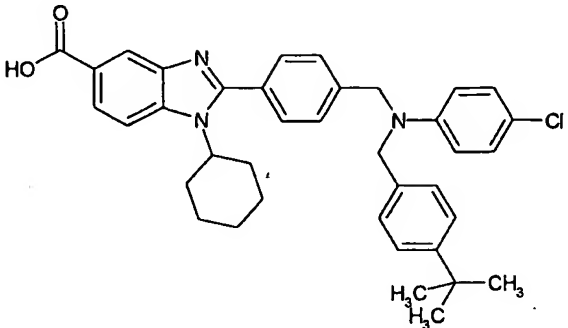
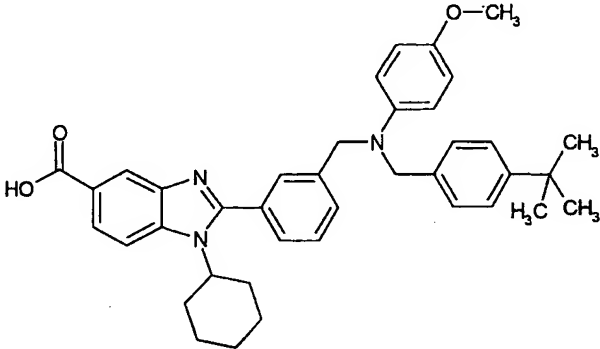
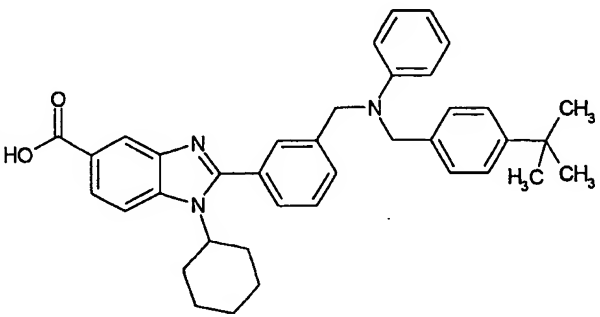
実施例 番号	式	MS
1522		573(M+H)
1523		606(M+H)
1524		602(M+H)
1525		572(M+H)

表 169

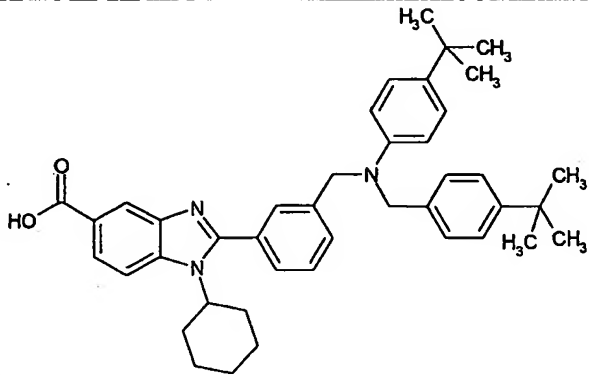
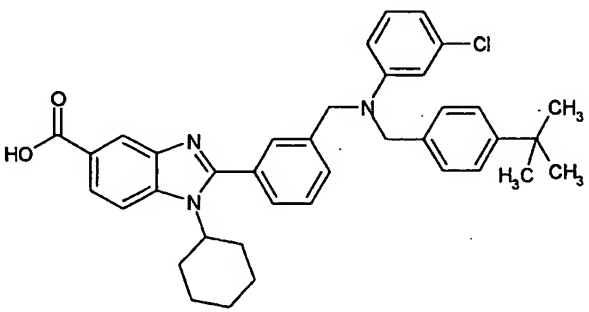
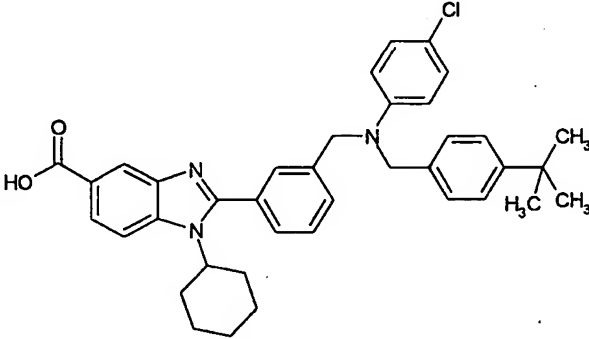
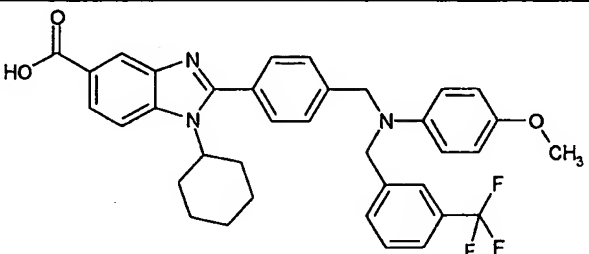
実施例 番号	式	MS
1526		628(M+H)
1527		606(M+H)
1528		606(M+H)
1529		614(M+H)

表170

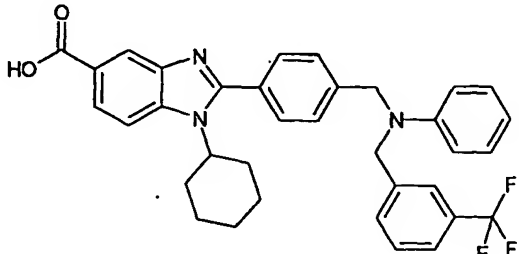
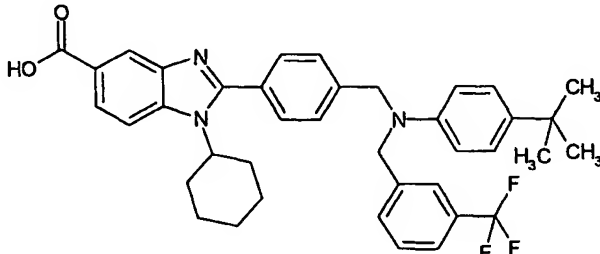
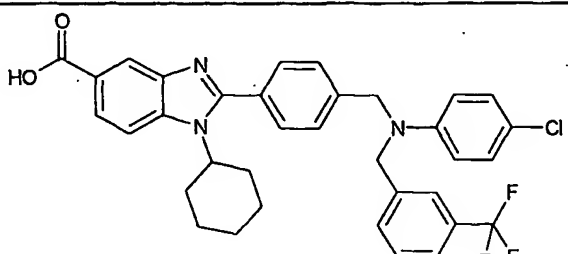
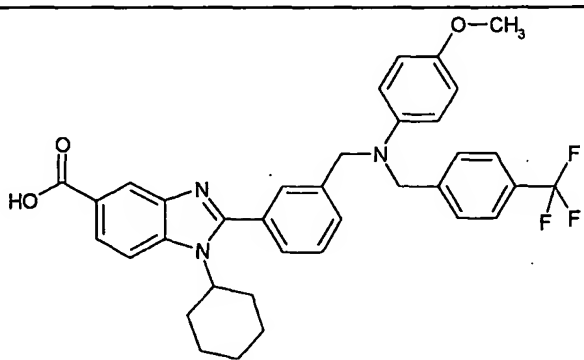
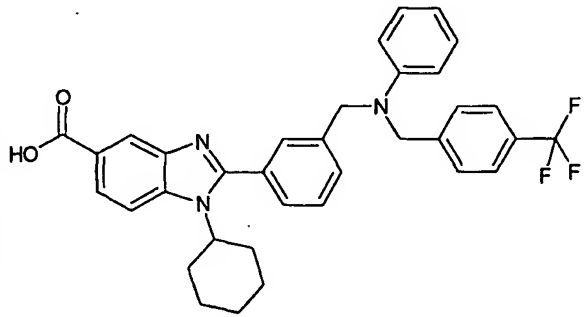
実施例 番号	式	MS
1530		584(M+H)
1531		640(M+H)
1532		618(M+H)
1533		614(M+H)
1534		584(M+H)

表171

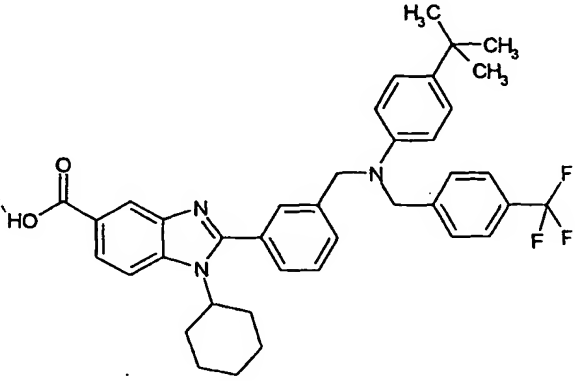
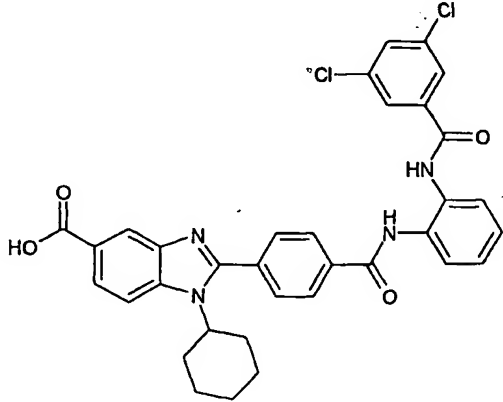
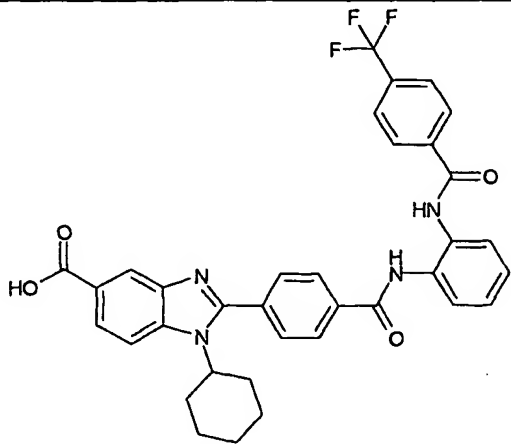
実施例 番号	式	MS
1535		640(M+H)
1536		627(M+H)
1537		627(M+H)

表172

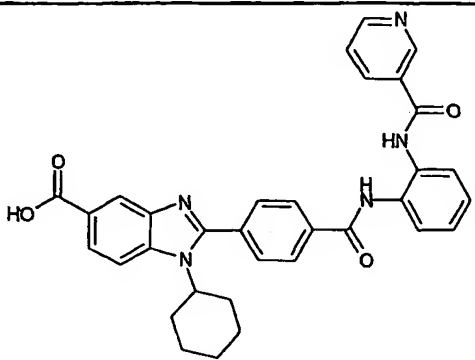
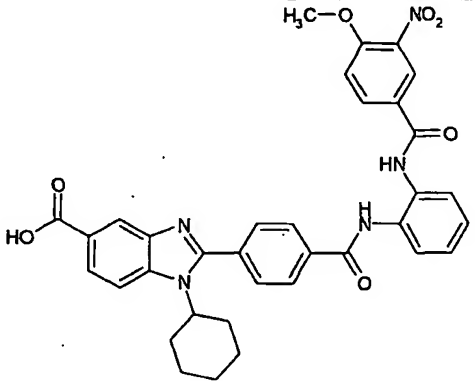
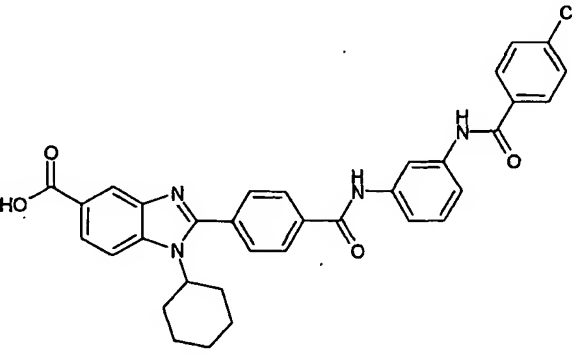
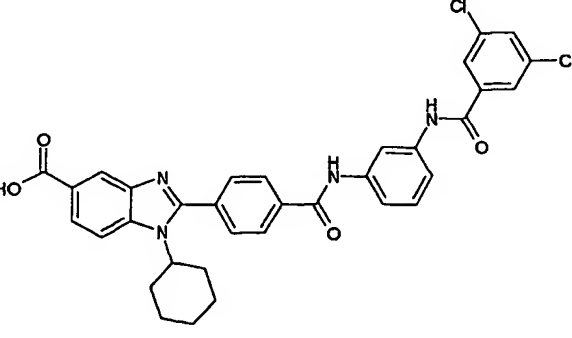
実施例 番号	式	MS
1538		560(M+H)
1539		634(M+H)
1540		593(M+H)
1541		627(M+H)

表173

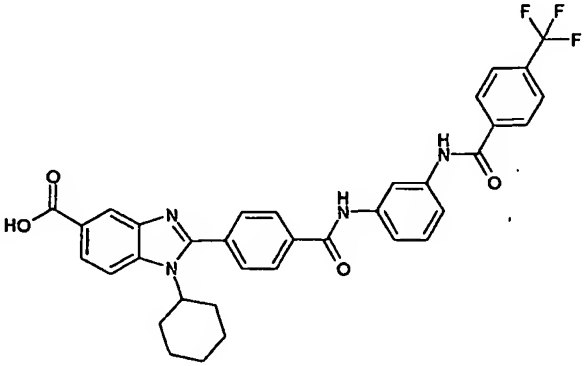
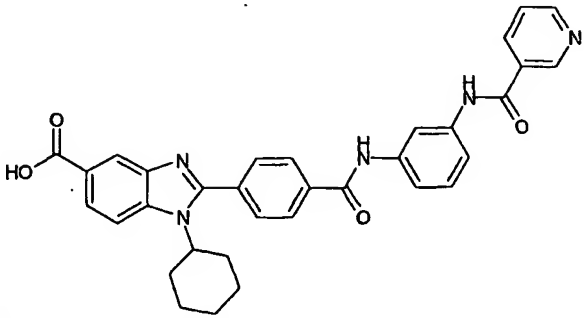
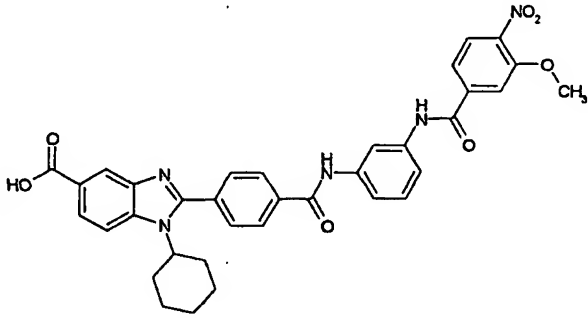
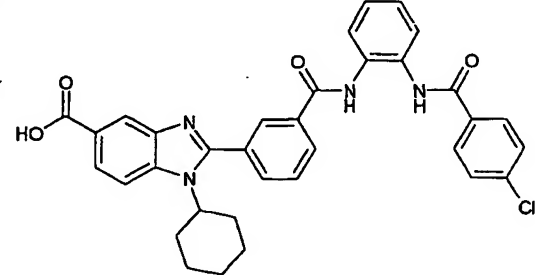
実施例 番号	式	MS
1542		627(M+H)
1543		560(M+H)
1544		634(M+H)
1545		593(M+H)

表174

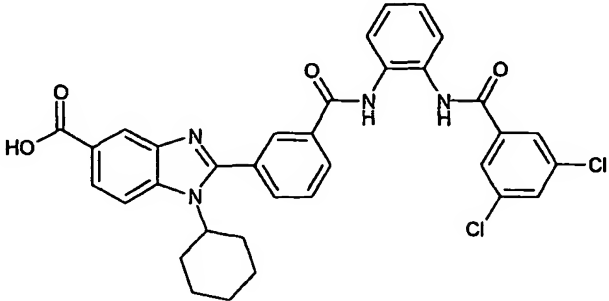
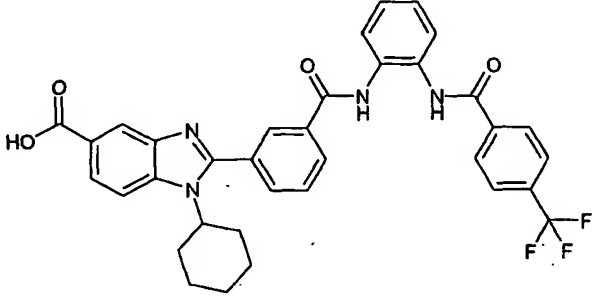
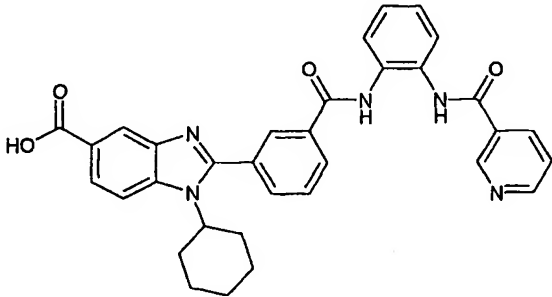
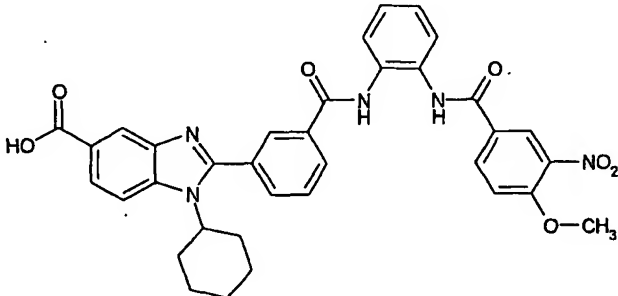
実施例 番号	式	MS
1546		627(M+H)
1547		627(M+H)
1548		560(M+H)
1549		634(M+H)



表175

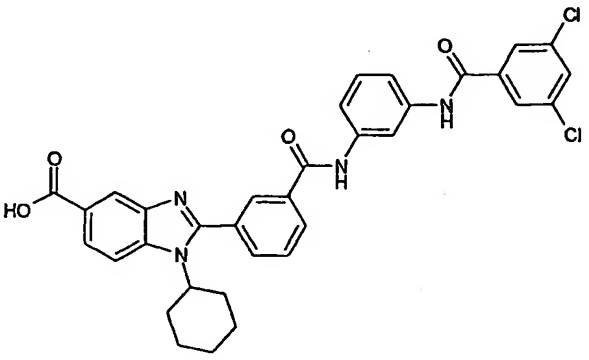
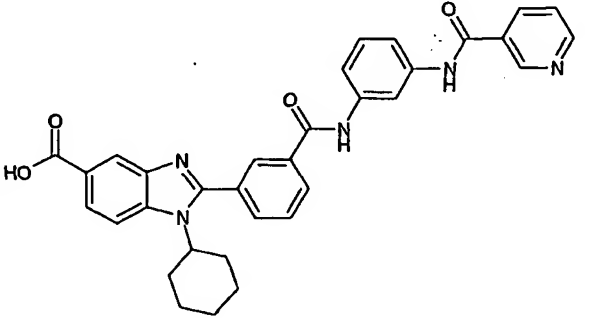
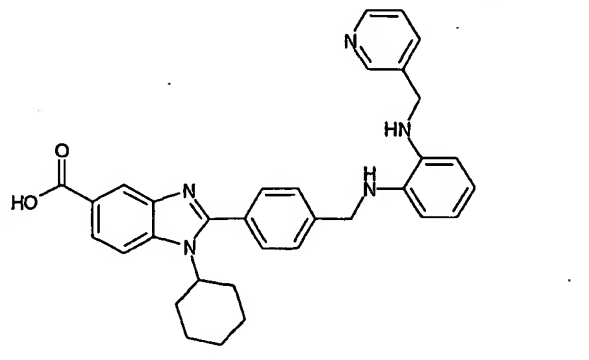
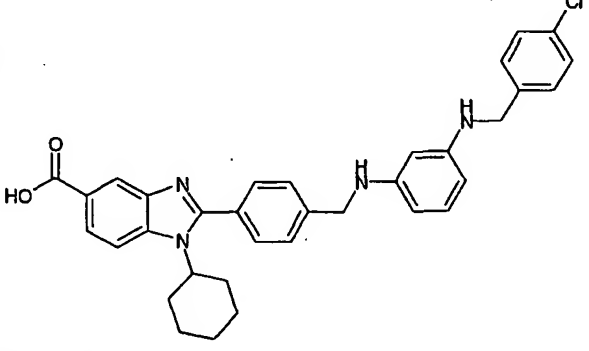
実施例 番号	式	MS
1550		627(M+H)
1551		560(M+H)
1552		532(M+H)
1553		565(M+H)

表176

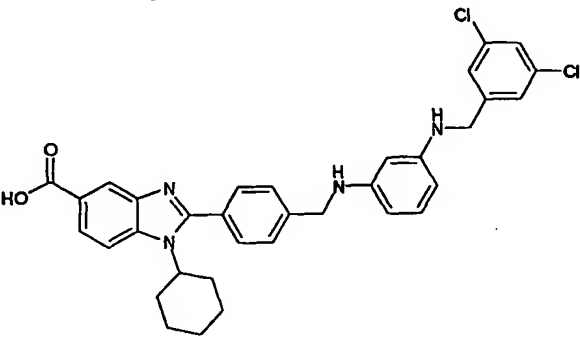
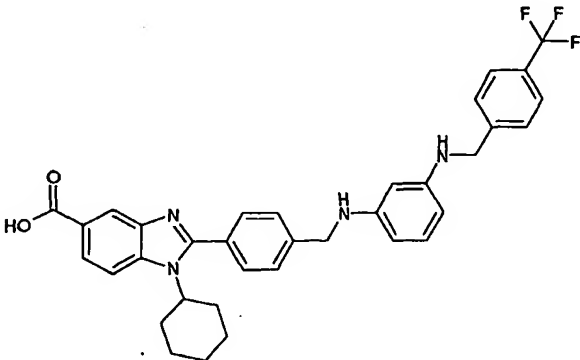
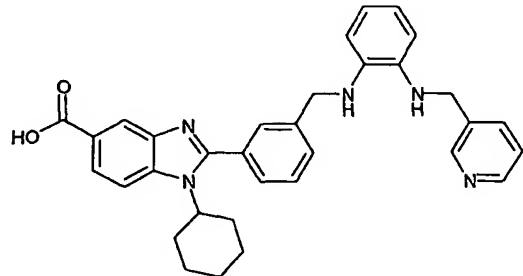
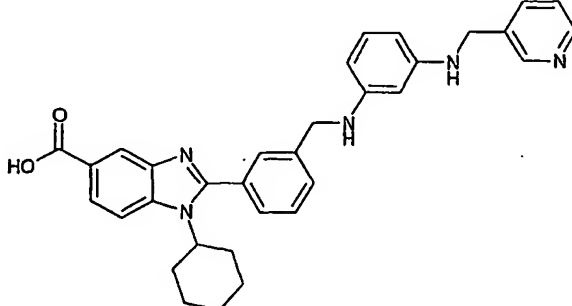
実施例 番号	式	MS
1554		599(M+H)
1555		599(M+H)
1556		532(M+H)
1557		532(M+H)

表177

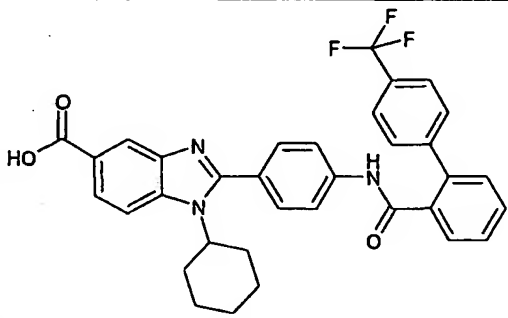
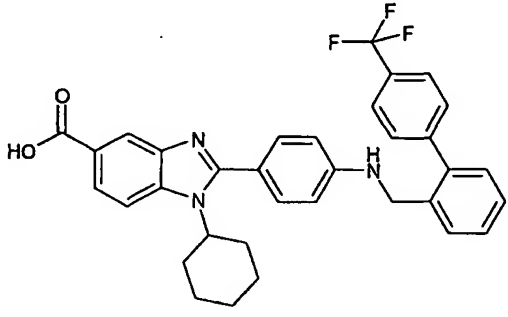
実施例 番号	式	MS
1558		584(M+H)
1559		570(M+H)

表 178

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
2	0.079	67	0.26
6	0.034	68	0.28
9	0.019	70	0.19
11	0.53	71	0.62
12	0.60	77	0.51
17	0.047	81	0.18
20	0.042	82	0.097
26	0.033	83	0.52
30	0.052	85	0.17
43	0.58	86	0.13
44	0.95	87	0.80
45	0.40	88	0.092
46	0.47	89	0.34
47	0.54	90	0.20
48	0.44	91	0.53
49	0.94	93	0.16
50	0.54	94	0.084
51	1.0	96	0.25
54	0.56	97	0.16
55	0.36	98	0.30

表 179

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC <sub>50</sub> [ $\mu$ M]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 IC <sub>50</sub> [ $\mu$ M]
99	0.53	120	0.16
100	0.78	121	0.19
101	0.14	122	0.51
103	0.17	123	0.10
104	0.073	124	0.091
105	0.076	125	0.12
106	0.40	128	0.14
107	0.11	129	0.12
108	0.21	130	0.16
109	0.11	131	0.046
110	0.24	132	0.055
111	0.14	133	0.12
112	0.11	134	0.071
113	0.071	139	0.26
114	0.56	140	0.11
115	0.17	141	0.43
116	0.37	142	0.055
117	0.075	143	0.053
118	0.14	144	0.19
119	0.13	145	0.088

表 180

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
146	0.043	167	0.033
147	0.31	168	0.078
148	0.038	169	0.15
149	0.15	170	0.048
150	0.24	171	0.050
151	0.20	172	0.10
153	0.19	173	0.14
154	0.076	174	0.030
155	0.53	175	0.29
156	0.23	176	0.053
157	0.16	177	0.077
158	0.11	178	0.052
159	0.13	179	0.63
160	0.24	180	0.11
161	0.062	181	0.71
162	0.43	182	0.021
163	0.15	183	0.017
164	0.16	184	0.018
165	0.58	185	0.11
166	0.055	186	0.37

表 1 8 1

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
187	0.056	207	0.081
188	0.038	208	0.039
189	0.017	209	0.12
190	0.020	210	0.31
191	0.43	211	0.059
192	0.22	212	0.23
193	0.13	213	0.10
194	0.52	214	0.059
195	0.023	215	0.078
196	0.20	216	0.084
197	0.11	217	0.058
198	0.044	218	0.033
199	0.11	219	0.13
200	0.10	220	0.073
201	0.14	221	0.058
202	0.095	222	0.041
203	0.063	223	0.21
204	0.16	225	0.014
205	0.077	227	0.045
206	0.05	228	0.18

表 182

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
229	0.022	257	0.074
230	0.17	259	0.10
231	0.073	260	0.27
232	0.015	262	0.013
233	0.028	263	0.035
234	0.022	264	<0.01
235	0.036	265	0.014
236	0.075	266	0.018
237	0.015	267	0.014
238	0.19	268	0.012
239	0.17	269	0.013
240	0.055	270	0.012
248	0.012	271	0.024
249	0.022	272	0.066
250	0.018	273	0.041
252	0.32	276	0.023
253	0.65	279	0.017
254	0.038	280	0.016
255	0.038	281	0.052
256	0.079	282	0.019



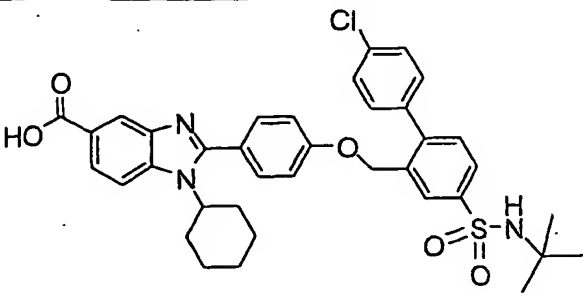
表 183

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
283	0.014	300	0.045
284	0.014	301	0.017
285	0.012	303	0.10
286	0.014	304	0.017
287	0.012	305	0.01
288	0.013	306	0.013
289	<0.01	307	0.022
290	0.012	308	0.023
291	0.016	311	0.16
292	0.015	312	0.023
293	0.034	313	0.025
294	0.032	314	0.097
295	0.045	315	0.028
296	0.034	316	0.022
297	0.022	317	0.032
298	0.011	318	0.012
299	0.018	319	0.030

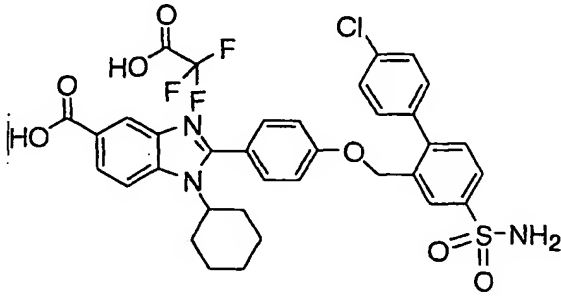
表 1 8 4

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
320	0.036	328	0.015
321	0.015	329	0.047
322	0.016	330	0.011
323	0.018	331	0.017
324	0.027	332	0.023
325	0.019	333	0.016
326	0.018	334	0.016
327	0.019	335	0.013

表 185

実施例番号	249	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.02 (1H, d, J=1.5Hz), 8.11 (1H, d, J=1.8Hz), 7.96-7.81 (3H, m), 7.67 (1H, s), 7.61-7.49 (6H, m), 7.08 (2H, d, J=8.6 Hz), 5.19 (2H, s), 4.25 (1H, m), 2.38-2.17 (2H, m), 1.96-1.78 (4H, m), 1.70-1.56 (1H, m), 1.46-1.16 (3H, m), 1.11 (9H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	672 (M+1)	

実施例番号	250	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.25 (1H, d, J=1.5Hz), 8.16-8.08 (2H, m), 7.99-7.88 (2H, m), 7.66 (2H, d, J=8.6Hz), 7.60-7.48 (5H, m), 7.19 (2H, d, J=8.6Hz), 5.17 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.39-2.20 (2H, m), 2.04-1.79 (4H, m), 1.72-1.60 (1H, m), 1.50-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	616 (M+1)	

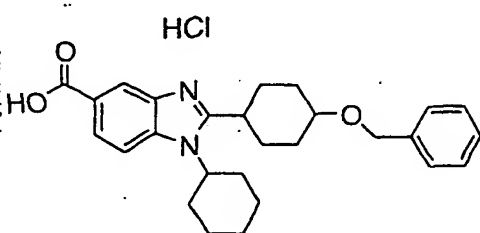
実施例番号	251	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 cis and trans mixture 8.13 and 8.11 (total 1H, each s), 7.90-7.74 (2H, m), 7.42-7.22 (5H, m), 4.56 and 4.52 (total 2H, each s), 4.42 (1H, brs), 3.78-3.06 (2H, m), 2.33-1.33 (18H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	433 (M+1)	

表 186

実施例番号	252	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.20 (1H, d, J=1.5Hz), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.84 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.54 (2H, d, J=6.9Hz), 7.48-7.26 (8H, m), 7.09 (1H, t, J=7.3Hz), 5.43 (2H, s), 4.06 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.01-1.80 (4H, m), 1.75-1.64 (1H, m), 1.51-1.28 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	509 (M+1)	

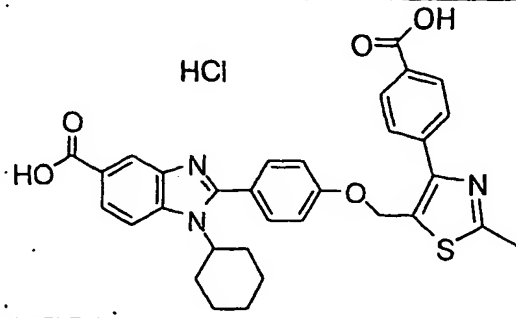
  

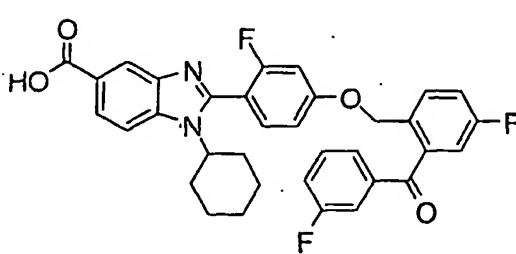
実施例番号	253	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.21 (1H, d, J=1.5Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz), 7.85 (1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.54-7.47 (2H, m), 7.40-7.24 (6H, m), 7.15 (1H, d, J=3.6Hz), 7.11-7.05 (1H, m), 6.81 (1H, d, J=3.6Hz), 5.26 (2H, s), 4.96 (1H, m), 2.32-2.13 (2H, m), 1.95-1.72 (4H, m), 1.68-1.55 (1H, m), 1.43-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	493 (M+1)	

実施例番号	254	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.25 (1H, s), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.90 (1H, dd, J=8.4, 1.4Hz), 7.80-7.71 (2H, m), 7.67 (2H, d, J=8.7Hz), 7.33 (2H, t, J=8.7Hz), 7.26 (2H, d, J=8.7Hz), 5.46 (2H, s), 4.78 (2H, s), 4.31 (1H, m), 2.39-2.19 (2H, m), 2.03-1.79 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.50-1.17 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	558 (M+1)	

表 187

実施例番号	255	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.34 (1H, s), 8.32 (1H, d, J=8.8Hz), 8.09-8.03 (3H, m), 7.83 (2H, d, J=8.3Hz), 7.79 (2H, d, J=8.8Hz), 7.36 (2H, d, J=8.8Hz), 5.54 (2H, s), 4.38 (1H, m), 2.74 (3H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.13-1.96 (2H, m), 1.93-1.78 (2H, m), 1.73-1.57 (1H, m), 1.55-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	568 (M+1)	

実施例番号	256	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.67 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.94 and 7.87 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.79 (1H, dd, J=8.7, 5.4Hz), 7.62-7.41 (7H, m), 6.80 (1H, dd, J=11.9, 2.3Hz), 6.69 (1H, dd, J=8.1, 2.1Hz), 5.20 (2H, s), 3.93 (1H, brt, J=15.3Hz), 2.30-2.11 (2H, brm), 1.88-1.74 (4H, brm), 1.64-1.58 (1H, brm), 1.41-1.14 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	585 (M+1)	

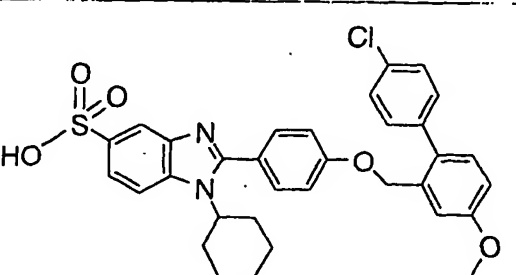
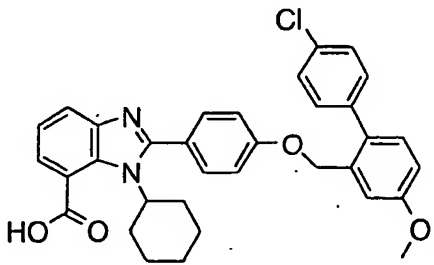
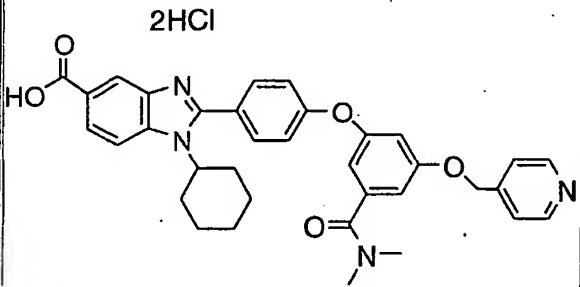
実施例番号	257	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.19 (1H, d, J=8.7Hz), 7.93 (1H, s), 7.83-7.71 (3H, m), 7.50-7.39 (4H, m), 7.34-7.10 (4H, m), 7.06 (1H, dd, J=8.4, 2.9Hz), 5.09 (2H, s), 4.34 (1H, m), 3.82 (3H, s), 2.39-2.19 (2H, m), 2.11-1.98 (2H, m), 1.94-1.79 (2H, m), 1.74-1.58 (1H, m), 1.52-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	603 (M+1)	

表 188

実施例番号	258	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 7.79 (1H, d, J=6.7Hz), 7.56 (1H, d, J=7.5Hz), 7.49 (2H, d, J=8.6Hz), 7.42 (4H, s), 7.32-7.23 (3H, m), 7.09-7.03 (3H, m), 5.02 (2H, s), 4.46 (1H, m), 3.82 (3H, s), 1.95-1.83 (2H, m), 1.75-1.44 (5H, m), 1.30-1.10 (2H, m), 0.89-0.71 (1H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	567 (M+1)	

実施例番号	259	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.93 (2H, d, J=6.6Hz), 8.36 (1H, s), 8.28 (1H, d, J=8.7Hz), 8.10-8.03 (3H, m), 7.85 (2H, d, J=8.7Hz), 7.33 (2H, d, J=8.7Hz), 7.23 (1H, s), 7.23 (1H, s), 6.81 (1H, s), 5.56 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.97, 2.92 (6H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.16-1.95 (2H, m), 1.90-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	591 (M+1)	

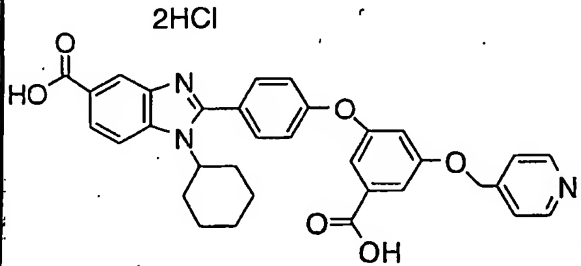
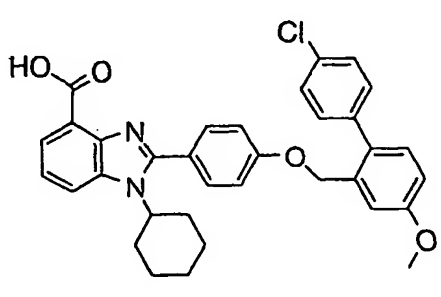
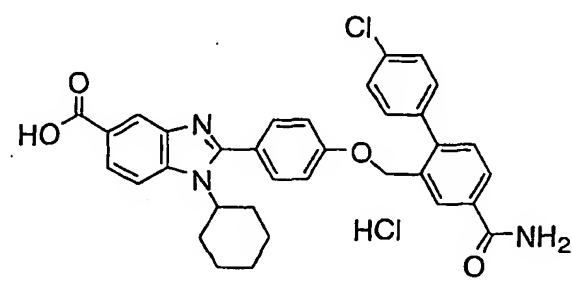
実施例番号	260	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.93 (2H, d, J=6.3Hz), 8.35 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 8.09-8.02 (3H, m), 7.86 (2H, d, J=8.7Hz), 7.50 (1H, s), 7.35 (2H, d, J=8.4Hz), 7.24 (2H, d, J=7.8Hz), 5.60 (2H, s), 4.39 (1H, m), 2.50-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	564 (M+1)	

表 189

実施例番号	261	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, d, J=7.8Hz), 7.85 (1H, d, J=6.7Hz), 7.63 (2H, d, J=9.0Hz), 7.51-7.38 (5H, m), 7.29 (1H, d, J=8.3Hz), 7.23 (1H, d, J=3.0Hz), 7.06 (2H, d, J=9.0Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.6, 3.0Hz), 5.05 (2H, s), 4.41-4.25 (1H, m), 3.83 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 2.03-1.78 (4H, m), 1.72-1.57 (1H, m), 1.50-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	567 (M+1)	

実施例番号	262	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.26 (1H, d, J=9.0Hz), 8.19 (1H, d, J=1.8Hz), 8.13 (1H, brs), 8.08-7.96 (2H, m), 7.73 (2H, d, J=9.0Hz), 7.57-7.43 (6H, m), 7.24 (2H, d, J=9.0Hz), 5.14 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.38-2.18 (2H, m), 2.12-1.97 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.73-1.58 (1H, m), 1.52-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	580 (M+1)	

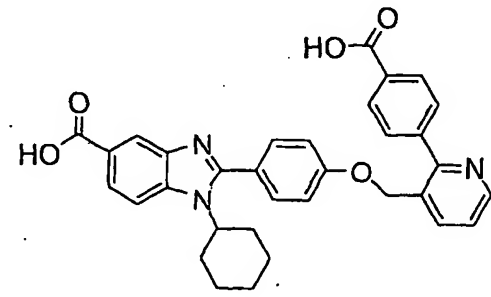
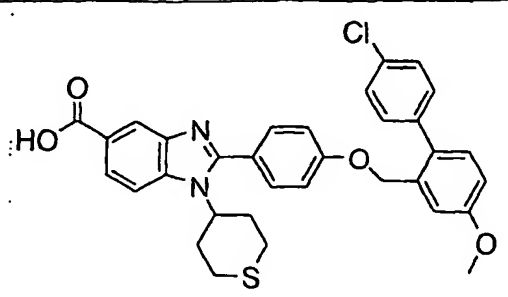
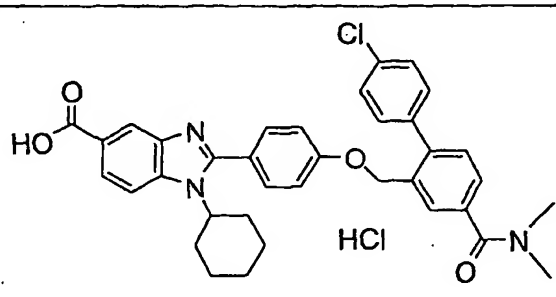
実施例番号	263	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.85 (1H, brs), 8.72 (1H, d, J=4.8Hz), 8.22 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=6.3Hz), 8.03 and 7.76 (4H, ABq, J=8.6Hz), 7.93a and 7.85 (2H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.60 and 7.15 (4H, A''B''q, J=8.7Hz), 7.55 (1H, dd, J=6.3, 4.8Hz), 5.19 (2H, s), 4.26 (1H, brt, J=12.6Hz), 2.35-2.18 (2H, brm), 1.95-1.77 (4H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.45-1.15 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	548 (M+1)	

表 190

実施例番号	264	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, d, J=1.0Hz), 7.92 (1H, dd, J=8.7, 1.0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.60 (2H, d, J=8.6Hz), 7.47 (2H, d, J=8.7Hz), 7.44 (2H, d, J=8.7Hz), 7.30 (1H, d, J=8.3Hz), 7.23 (1H, d, J=2.6Hz), 7.11 (2H, d, J=8.7Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.7, 2.6Hz), 5.04 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.83 (3H, s), 2.80-2.70 (4H, m), 2.60-2.40 (2H, m), 2.30-2.20 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	586, 588 (M+1)	

実施例番号	265	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.25 (1H, d, J=9.1Hz), 8.03 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.76-7.96 (3H, m), 7.55-7.49 (5H, m), 7.42 (1H, d, J=7.6Hz), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.37-2.20 (2H, m), 2.09-1.97 (2H, m), 1.94-1.81 (2H, m), 1.72-1.60 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	608 (M+1)	

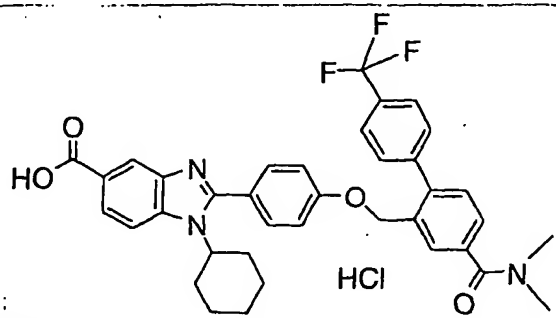
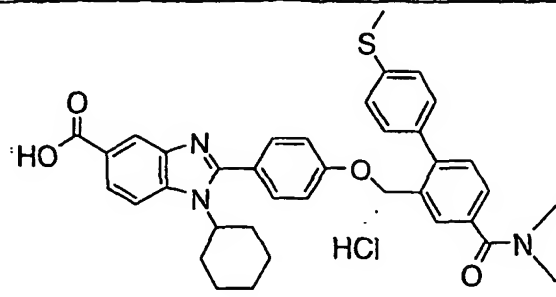
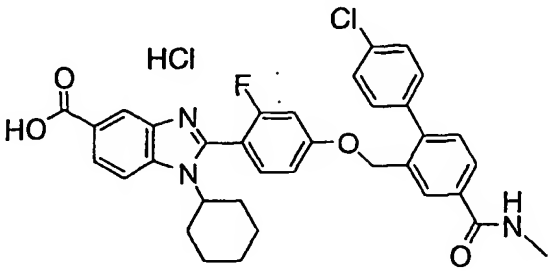
実施例番号	266	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, d, J=1.5Hz), 8.20 (1H, d, J=9.0Hz), 8.00 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.82 (2H, d, J=8.2Hz), 7.76-7.65 (5H, m), 7.56 (1H, dd, J=7.9, 1.8Hz), 7.47 (1H, d, J=7.5Hz), 7.20 (2H, d, J=8.6Hz), 5.16 (2H, s), 4.32 (1H, m), 3.02 (3H, s), 2.98 (3H, s), 2.38-2.19 (2H, m), 2.07-1.95 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.72-1.58 (1H, m), 1.52-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	642 (M+1)	



表 191

実施例番号	267	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.34 (2H, m), 8.03 (1H, d, J=8.3Hz), 7.77-7.68 (3H, m), 7.54-7.40 (4H, m), 7.33 (2H, d, J=8.6Hz), 7.24 (2H, d, J=9.0Hz), 5.16 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 2.11-1.97 (2H, m), 1.93-1.81 (2H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.50-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	620 (M+1)	

実施例番号	268	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.67-8.59 (1H, m), 8.30 (1H, s), 8.13-8.20 (2H, m), 8.02-7.92 (2H, m), 7.65 (1H, t, J=8.3Hz), 7.56-7.45 (5H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.6, 2.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.09 (1H, m), 2.82 (3H, d, J=4.5Hz), 2.34-2.12 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.71-1.59 (1H, m), 1.49-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	612 (M+1)	

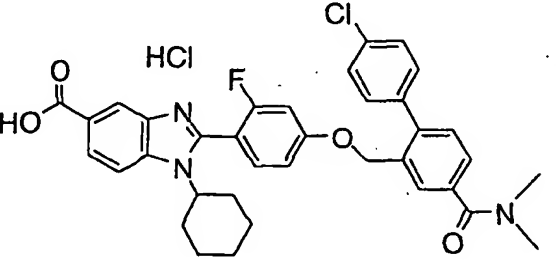
実施例番号	269	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=9.0Hz), 7.97 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.71 (1H, d, J=1.8Hz), 7.63 (1H, t, J=8.2Hz), 7.56-7.41 (6H, m), 7.17 (1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.03 (1H, dd, J=8.2, 1.8Hz), 5.14 (2H, s), 4.15-4.00 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.98 (3H, s), 2.32-2.13 (2H, m), 1.95-1.79 (4H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.45-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	

表 192

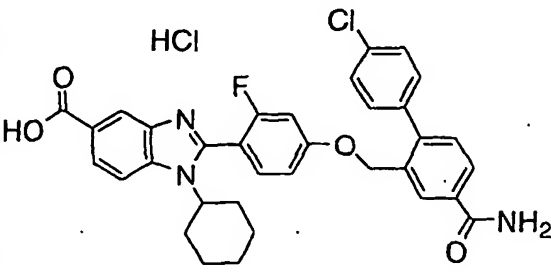
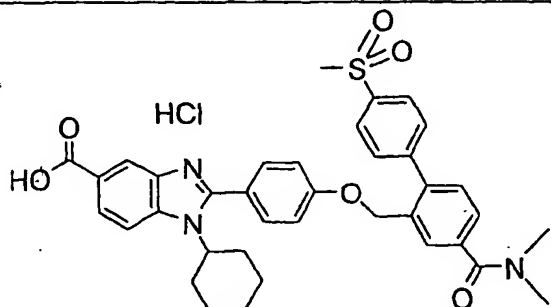
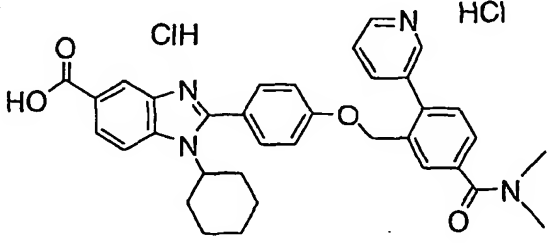
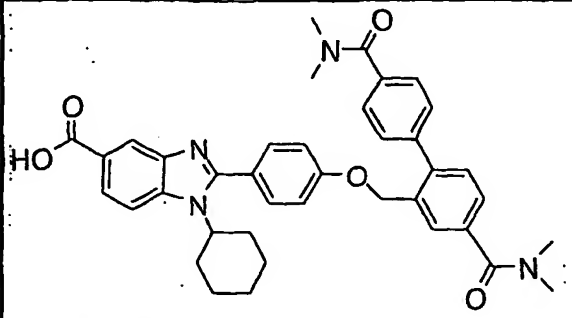
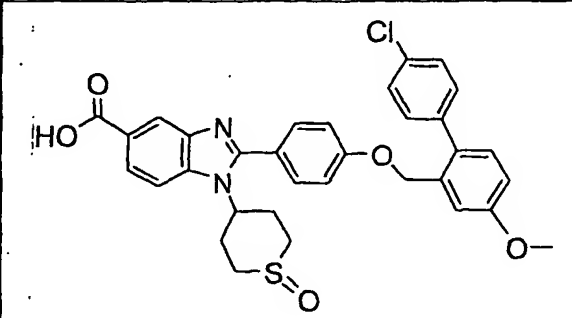
実施例番号	270	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.24 (1H, d, J=1.4Hz), 8.19 (1H, d, J=1.8Hz), 8.11 (1H, br s), 8.02-7.85 (3H, m), 7.60-7.44 (7H, m), 7.10 (1H, dd, J=12.0, 2.1Hz), 6.98 (1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 5.11 (2H, s), 3.98 (1H, m), 2.30-2.12 (2H, m), 1.91-1.73 (4H, m), 1.71-1.58 (1H, m), 1.45-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	598 (M+1)	
実施例番号	271	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.24 (1H, d, J=8.7Hz), 8.07-7.98 (3H, m), 7.80-7.68 (5H, m), 7.56 (1H, dd, J=8.0, 1.8Hz), 7.47 (1H, d, J=8.0Hz), 7.21 (2H, d, J=8.4Hz), 5.18 (2H, s), 4.34 (1H, m), 3.27 (3H, s), 3.02 (3H, s), 2.98 (3H, s), 2.38-2.18 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.93-1.79 (2H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.50-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	652 (M+1)	
実施例番号	272	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.97 (1H, d, J=1.8Hz), 8.85 (1H, d, J=4.7Hz), 8.46 (1H, d, J=8.0Hz), 8.39-8.26 (2H, m), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.99-7.64 (6H, m), 7.24 (2H, d, J=8.7Hz), 5.25 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.03 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.39-2.19 (2H, m), 2.14-1.96 (2H, m), 1.94-1.78 (2H, m), 1.73-1.60 (1H, m), 1.21-1.55 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	575 (M+1)	

表 193

実施例番号	273	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.77-7.67 (3H, m), 7.58-7.48 (6H, m), 7.22 (2H, d, J=8.4Hz), 5.18 (2H, s), 4.35 (1H, brt, J=9.8Hz), 3.06-2.88 (12H, brm), 2.38-2.20 (2H, brm), 2.08-1.96 (2H, brm), 1.90-1.80 (2H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.49-1.22 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	645 (M+1)	

実施例番号	274	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 mixture of cis and trans 8.35, 8.34 (1H, s), 8.15-8.10 (2H, m), 7.79-7.70 (3H, m), 7.49 (2H, d, J=8.7Hz), 7.44 (2H, d, J=8.7Hz), 7.31 (1H, d, J=8.4Hz), 7.25-7.19 (2H, m), 7.07 (1H, d, J=8.5Hz), 5.08 (2H, s), 4.75 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.70-1.90 (8H, m)
純度	約 80% (NMR)	
MS	601 (M+1)	

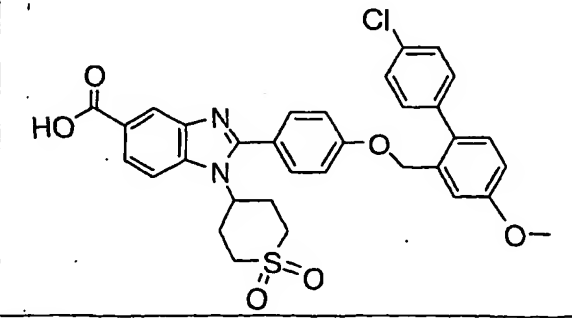
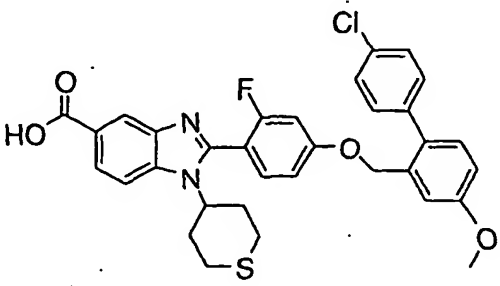
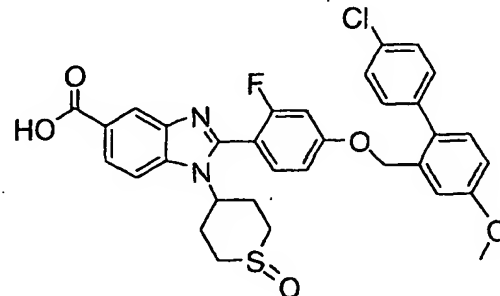
実施例番号	275	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=7.5Hz), 7.93 (1H, d, J=8.8Hz), 7.74 (2H, d, J=8.7Hz), 7.49 (2H, d, J=8.6Hz), 7.44 (2H, d, J=8.6Hz), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.25-7.15 (3H, m), 7.07 (1H, d, J=8.5Hz), 5.08 (2H, s), 4.98 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.65-3.45 (2H, m), 3.30-3.10 (2H, m), 3.00-2.75 (2H, m), 2.60-2.30 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	617 (M+1)	

表 194

実施例番号	276	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.25 (1H, s), 7.93 and 7.87 (2H, ABq, J=9.1Hz), 7.55 (1H, t, J=8.6Hz), 7.48 and 7.42 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.24 (1H, d, J=2.6Hz), 7.09-6.95 (3H, m), 5.05 (2H, s), 4.11 (1H, brt, J=14.0Hz), 3.84 (3H, s), 2.83-2.67 (4H, brm), 2.50-2.32 (2H, brm), 2.21-2.10 (2H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	603 (M+1)	

実施例番号	277	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> cis and trans mixture 8.28 and 8.24 (total 1H, each s), 7.94-7.87 (1H, m), 7.60-7.41 (5H, m), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.23-7.21 (1H, m), 7.12-7.05 (2H, m), 7.00-6.95 (1H, m), 5.06 and 5.05 (total 2H, each s), 4.47 and 4.34 (total 1H, each brs), 3.83 (3H, s), 3.12-1.76 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	619 (M+1)	

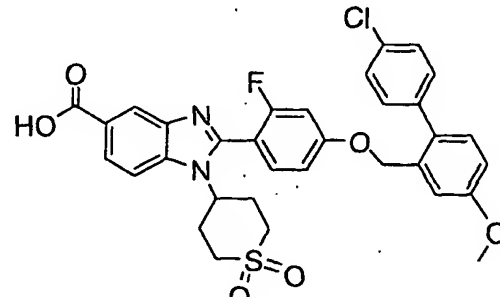
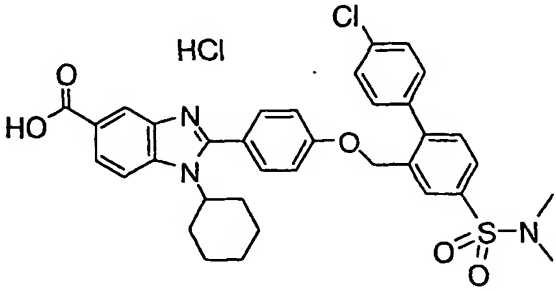
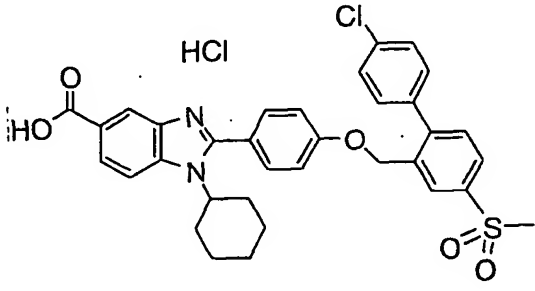
実施例番号	278	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.9 (1H, brs), 8.27 (1H, s), 7.97 and 7.74 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.58 (1H, t, J=8.6Hz), 7.49 and 7.43 (4H, A'B'q, J=8.5Hz), 7.31 (1H, d, J=8.5Hz), 7.22 (1H, d, J=2.6Hz), 7.13-6.92 (3H, m), 5.05 (2H, s), 4.67 (1H, brt, J=14.2Hz), 3.57-3.40 (2H, brm), 3.20-3.05 (2H, brm), 2.91-2.70 (2H, brm), 2.28-2.11 (2H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	635 (M+1)	

表 195

実施例番号	279	1H NMR(δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30(1H, s), 8.23(1H, d, J=8.7Hz), 8.06-8.00(2H, m), 7.83(1H, dd, J=8.0, 1.8Hz), 7.71(2H, d, J=8.4Hz), 7.64(1H, d, J=8.0Hz), 7.59-7.54(4H, m), 7.22(2H, d, J=8.4Hz), 5.25(2H, s), 4.33(1H, m), 2.66(3H, s), 2.66(3H, s), 2.37-2.19(2H, m), 1.93-1.80(2H, m), 1.70-1.59(1H, m), 1.47-1.21(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	644 (M+1)	

実施例番号	280	1H NMR(δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.32-8.23(3H, m), 8.08-8.01(2H, m), 7.73(2H, d, J=8.6Hz), 7.65(1H, d, J=8.2Hz), 7.59-7.51(4H, m), 7.25(2H, d, J=8.6Hz), 5.21(2H, s), 4.34(1H, m), 3.32(3H, s), 2.37-2.19(2H, m), 2.10-1.98(2H, m), 1.93-1.80(2H, m), 1.71-1.60(1H, m), 1.51-1.21(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	615 (M+1)	

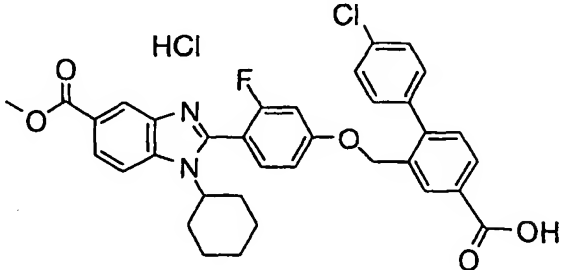
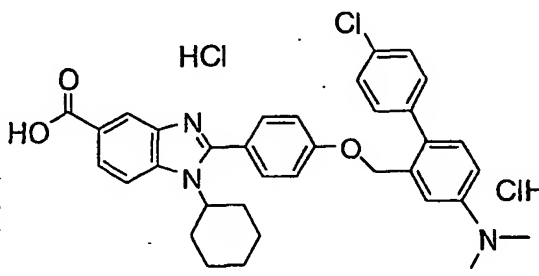
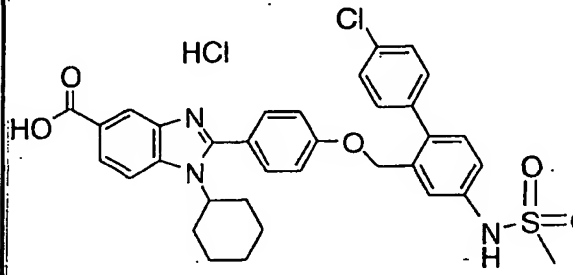
実施例番号	281	1H NMR(δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30(1H, d, J=1.5Hz), 8.24(1H, s), 8.14(1H, d, J=8.6Hz), 8.07-7.95(2H, m), 7.63(1H, t, J=8.6Hz), 7.57-7.47(5H, m), 7.16(1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.03(1H, dd, J=8.6, 2.2Hz), 5.17(2H, s), 4.06(1H, m), 3.90(3H, s), 2.31-2.11(2H, m), 1.97-1.78(4H, m), 1.71-1.59(1H, m), 1.43-1.22(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	315	

表 196

実施例番号	282	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.36 (1H, s), 8.35 (1H, d, J=9.3Hz), 8.09 (1H, d, J=9.3Hz), 7.78 (2H, d, J=8.7Hz), 7.48-7.25 (9H, m), 5.09 (2H, s), 4.39 (1H, m), 3.04 (6H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.90-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	580 (M+1)	

実施例番号	283	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 10.03 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.7Hz), 8.06 (1H, d, J=9.0Hz), 7.74 (2H, d, J=9.0Hz), 7.51-7.42 (5H, m), 7.37-7.30 (2H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.10 (2H, s), 4.37 (1H, m), 3.06 (3H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	630 (M+1)	

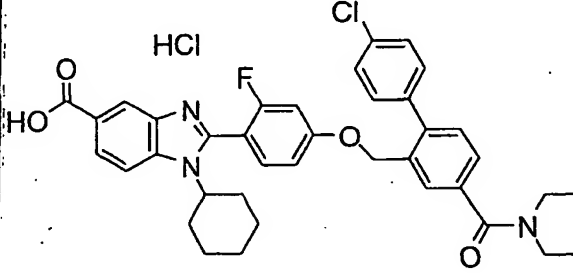
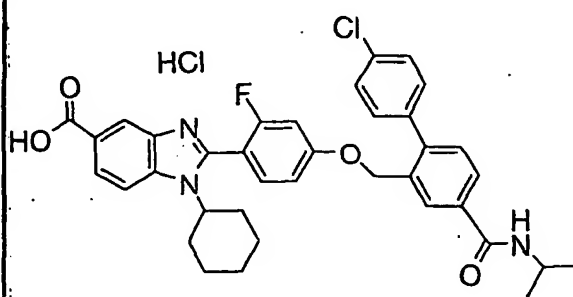
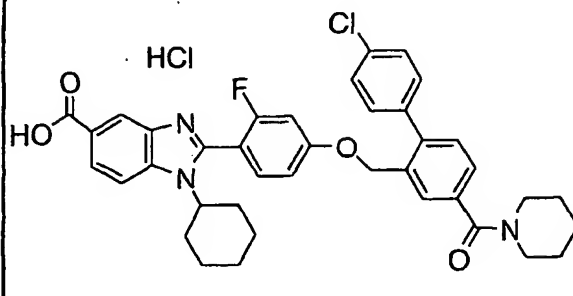
実施例番号	284	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96-7.41 (8H, m), 7.16 (1H, dd, J=12.4, 2.2Hz), 7.03 (1H, dd, J=8.4, 2.2Hz), 5.15 (2H, s), 4.15 (1H, m), 3.54-3.16 (4H, m), 2.33-2.13 (2H, m), 1.97-1.79 (4H, m), 1.70-1.02 (9H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	

表 197

実施例番号	285	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.37 (1H, d, J=7.3Hz), 8.30 (1H, s), 8.19-8.12 (2H, m), 8.02-7.95 (2H, m), 7.65 (1H, t, J=8.4Hz), 7.56-7.43 (5H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.0, 1.8Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 5.13 (2H, s), 4.22-4.03 (2H, m), 2.34-2.13 (2H, m), 1.99-1.78 (4H, m), 1.72-1.57 (1H, m), 1.44-1.14 (3H, m), 1.20, 1.18 (6H, each s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

実施例番号	286	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, dd, J=8.7, 1.4Hz), 7.69-7.40 (8H, m), 7.16 (1H, dd, J=12.0, 2.2Hz), 7.02 (1H, dd, J=8.4, 2.2Hz), 5.15 (2H, s), 4.07 (1H, m), 3.71-3.23 (2H, m), 1.98-1.71 (4H, m), 1.71-1.18 (10H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	666 (M+1)	

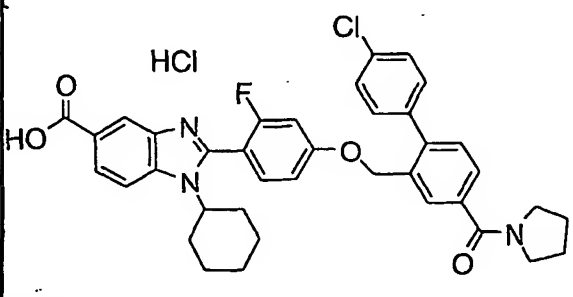
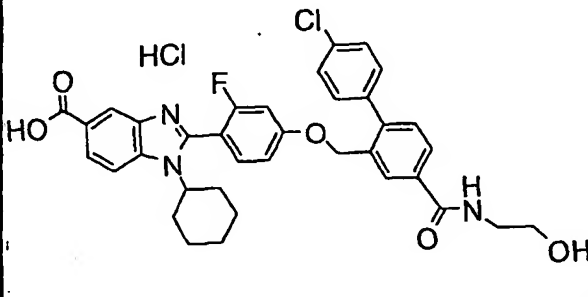
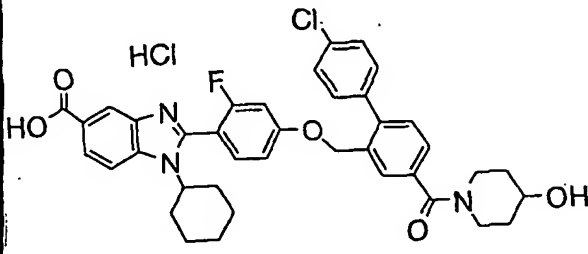
実施例番号	287	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.0Hz), 7.97 (1H, d, J=8.4Hz), 7.83 (1H, s), 7.68-7.41 (7H, m), 7.17 (1H, d, J=12.0Hz), 7.03 (1H, d, J=8.4Hz), 5.15 (2H, s), 4.07 (1H, m), 3.58-3.41 (4H, m), 2.34-2.13 (2H, m), 1.97-1.77 (8H, m), 1.71-1.58 (1H, m), 1.49-1.18 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	652 (M+1)	

表 198

実施例番号	288	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.62 (1H, m), 8.31 (1H, s), 8.22-8.14 (2H, m), 8.99 (2H, d, J=8.7Hz), 7.66 (1H, t, J=7.7 Hz), 7.58-7.44 (5H, m), 7.19 (1H, dd, J=8.7, 2.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.11 (1H, m), 3.67-3.49 (2H, m), 3.45-3.30 (2H, m), 2.37-2.12 (2H, m), 2.00-1.76 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.48-1.17 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	642 (M+1)	

実施例番号	289	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.28 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.9Hz), 7.96 (1H, d, J=8.9Hz), 7.68 (1H, s), 7.62 (1H, t, J=8.2Hz), 7.55-7.41 (6H, m), 7.15 (1H, d, J=11.7Hz), 7.02 (1H, d, J=8.4Hz), 5.14 (2H, s), 4.12-3.13 (6H, m), 2.30-1.19 (13H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	682 (M+1)	

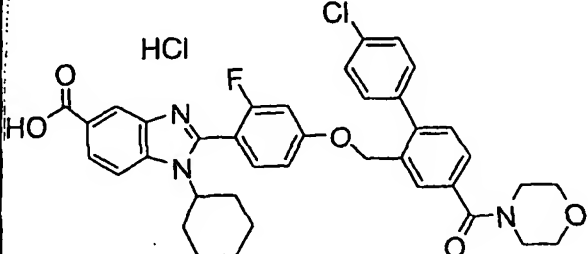
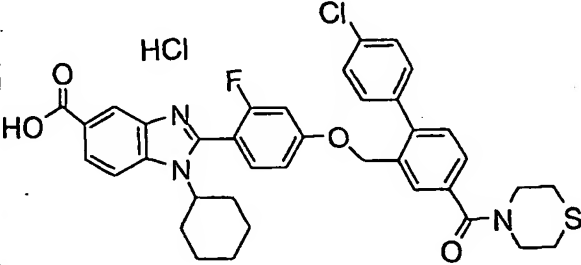
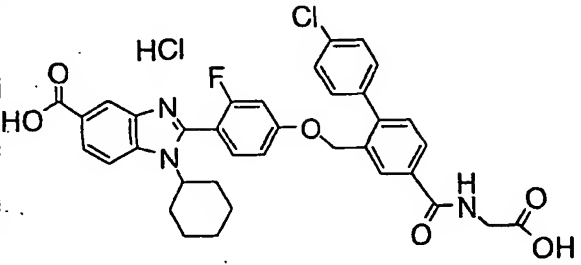
実施例番号	290	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=8.6Hz), 7.98 (1H, d, J=8.8Hz), 7.72 (1H, s), 7.64 (1H, t, J=8.8Hz), 7.57-7.43 (6H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.1, 2.1Hz), 7.03 (1H, d, J=10.7Hz), 5.12 (2H, s), 4.15-4.01 (1H, m), 3.75-3.33 (8H, m), 2.31-2.14 (2H, m), 1.96-1.78 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.47-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	668 (M+1)	



表 199

実施例番号	291	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.9Hz), 7.97 (1H, d, J=8.6Hz), 7.71 (1H, s), 7.63 (1H, t, J=8.2Hz), 7.56-7.42 (6H, m), 7.17 (1H, d, J=12.3Hz), 7.03 (1H, d, J=10.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.07 (1H, m), 3.96-3.52 (4H, m), 2.79-2.56 (4H, m), 2.32-2.14 (2H, m), 1.97-1.79 (4H, m), 1.71-1.58 (1H, m), 1.51-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	684 (M+1)	

実施例番号	292	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.07-8.99 (1H, m), 8.30 (1H, s), 8.23-8.12 (2H, m), 8.04-7.95 (2H, m), 7.65 (1H, t, J=8.2Hz), 7.60-7.45 (5H, m), 7.19 (1H, dd, J=12.0, 2.6Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.6, 2.2Hz), 5.16 (2H, s), 4.18-4.02 (1H, m), 3.97 (2H, d, J=6.0Hz), 2.33-2.14 (2H, m), 1.99-1.79 (4H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.45-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	656 (M+1)	

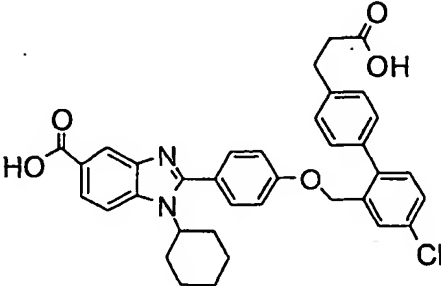
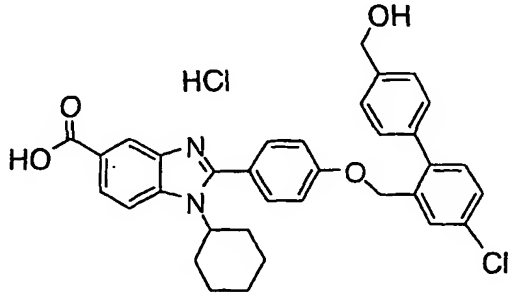
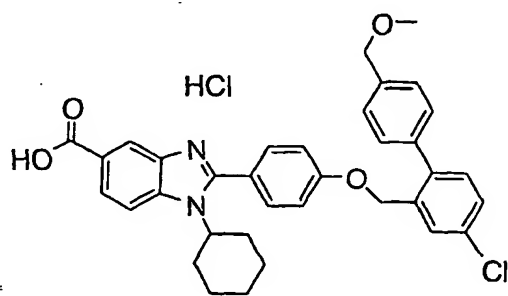
実施例番号	293	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6: 8.21 (1H, s), 7.94 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz), 7.72 (1H, d, J=2.4Hz), 7.59 and 7.11 (4H, A'B'q, J=8.9Hz), 7.53 (1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.38 (1H, d, J=8.4Hz), 7.36 and 7.32 (4H, A~B~q, J=8.1Hz), 5.07 (2H, s), 4.27 (1H, brt, J=13.8Hz), 2.87 (2H, t, J=7.8Hz), 2.57 (2H, t, J=7.8Hz), 2.35-2.20 (2H, brm), 1.96-1.79 (4H, brm), 1.68-1.59 (1H, brm), 1.47-1.18 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	637 (M+1)	

表 200

実施例番号	294	1H NMR(δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, s), 8.25 and 8.03 (2H, ABq, J=8.9Hz), 7.73 (1H, s), 7.73 (2H, d, J=8.6Hz), 7.55 (1H, dd, J=8.0, 2.3Hz), 7.40 (4H, s), 7.39 (1H, d, J=8.0Hz), 7.23 (2H, d, J=8.6Hz), 5.11 (2H, s), 4.55 (2H, s), 4.36 (1H, brt, J=14.8Hz), 2.37-2.19 (2H, brm), 2.09-1.96 (2H, brm), 1.91-1.79 (2H, brm), 1.71-1.59 (1H, brm), 1.50-1.20 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	567 (M+1)	

実施例番号	295	1H NMR(δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, s), 8.25 and 8.04 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.74 (1H, s), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.56 (1H, d, J=8.7Hz), 7.48-7.35 (5H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.46 (2H, s), 4.35 (1H, brt, J=14.8Hz), 3.31 (3H, s), 2.37-2.17 (2H, brm), 2.07-1.95 (2H, brm), 1.92-1.79 (2H, brm), 1.73-1.56 (1H, brm), 1.52-1.20 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	581 (M+1)	

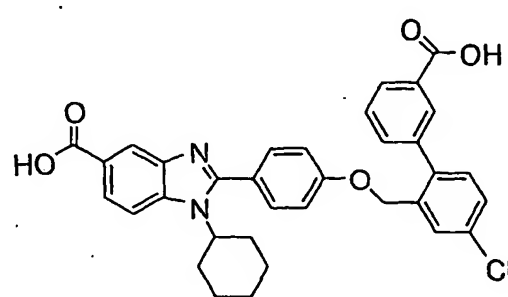
実施例番号	296	1H NMR(δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.21 (1H, d, J=1.5Hz), 7.98 (1H, d, J=1.2Hz), 7.97-7.91 (2H, m), 7.84 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.77 (1H, d, J=2.1Hz), 7.70 (1H, d, J=7.5Hz), 7.60-7.54 (4H, m), 7.43 (1H, d, J=8.4Hz), 7.09 (2H, d, J=8.7Hz), 5.05 (2H, s), 4.25 (1H, brt, J=14.8Hz), 2.36-2.18 (2H, brm), 1.95-1.79 (4H, brm), 1.71-1.6 (1H, brm), 1.43-1.18 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	581 (M+1)	

表 201

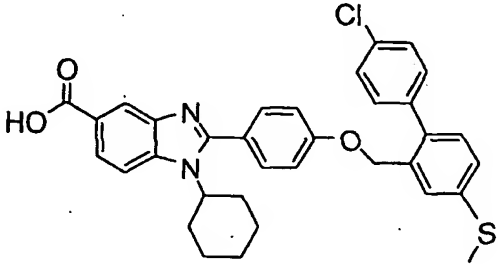
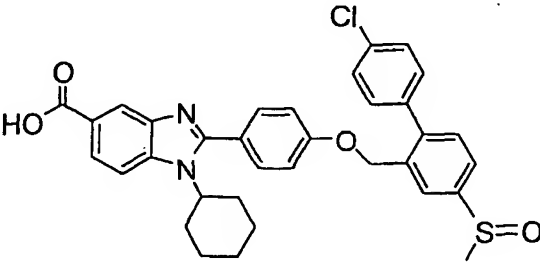
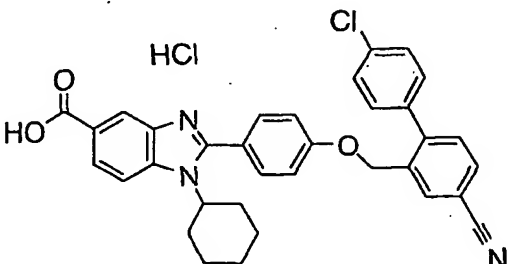
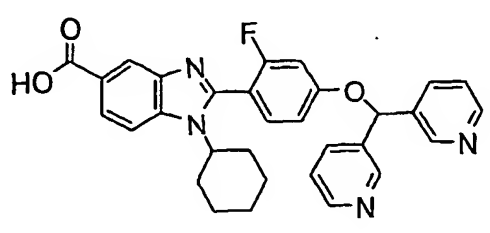
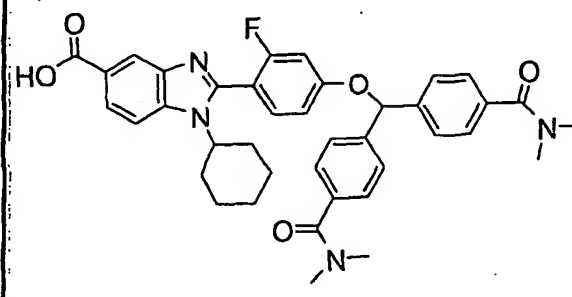
実施例番号	297	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.7 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 7.94 and 7.85 (2H, ABq, J=8.6 Hz), 7.60-7.55 (3H, m), 7.49 and 7.45 (4H, A' B' q, J=8.3Hz , 7.12 (2H, d, J=8.7Hz), 5.0 5 (2H, s), 4.26 (1H, brt, J=13 .0Hz), 2.54 (3H, s), 2.38-2. 20 (2H, brm), 1.97-1.80 (4H, brm), 1.71-1.59 (1H, brm), 1 .47-1.20 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	583 (M+1)	
実施例番号	298	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.22 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7. 95 and 7.86 (2H, ABq, J=8.6Hz , 7.79 (1H, d, J=7.8Hz), 7.5 8 (3H, t, J=7.5Hz), 7.53 (4H, s), 7.13 (2H, d, 8.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.26 (1H, brt, J=13. 8Hz), 2.83 (3H, s), 2.37-2.1 8 (2H, brm), 1.95-1.78 (4H, b rm), 1.70-1.59 (1H, brm), 1. 47-1.17 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	599 (M+1)	
実施例番号	299	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.43-8.16 (3H, m), 8.07-7.9 4 (2H, m), 7.72 (2H, d, J=8.6H z), 7.62-7.49 (5H, m), 7.23 (2 H, d, J=8.6Hz), 5.16 (2H, s) , 4.34 (1H, m), 2.39-2.20 (2H , m), 2.10-1.96 (2H, m), 1.93 -1.80 (2H, m), 1.71-1.58 (1H , m), 1.49-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	562 (M+1)	

表 202

実施例番号	300	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> : 2.77 (1H, brs), 8.83 (2H, d, J=1.9Hz), 8.56 (2H, dd, J=4.9, 1.9Hz), 8.22 (1H, d, J=1.5Hz), 7.97 (2H, dt, J=7.9, 1.9Hz), 7.95 (1H, d, J=8.6Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.57 (1H, t, J=8.7Hz), 7.46 (2H, dd, J=7.9, 4.9Hz), 7.26 (1H, dd, J=12.0, 4.9Hz), 7.14 (1H, dd, J=8.8, 2.3Hz), 6.99 (2H, s), 3.94 (1H, brt), 2.26-2.09 (2H, m), 1.87-1.73 (4H, m), 1.67-1.57 (1H, m), 1.42-1.12 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	523 (M+1)	

実施例番号	301	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.22 (1H, s), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, dd, J=1.5Hz, 9.0Hz), 7.62 (4H, d, J=8.4Hz), 7.55 (1H, t, J=9.0Hz), 7.44 (4H, d, J=8.1Hz), 7.20 (1H, dd, J=2.1Hz, 12.0Hz), 7.11 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.7Hz), 6.86 (1H, s), 3.94 (1H, m), 2.96, 2.88 (12H, s), 2.35-2.00 (2H, m), 1.95-1.70 (4H, m), 1.65-1.50 (1H, m), 1.45-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	663 (M+1)	

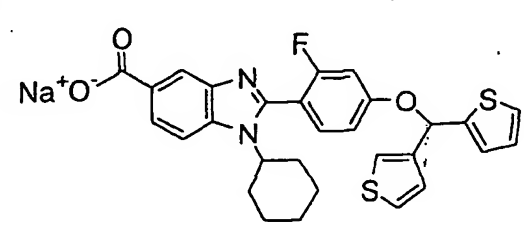
実施例番号	302	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.14 (1H, s), 7.88 (1H, d, J=8.4Hz), 7.68 (1H, d, J=8.7Hz), 7.64-7.55 (3H, m), 7.50 (1H, t, J=8.7Hz), 7.22-7.17 (3H, m), 7.11 (1H, s), 7.08-7.00 (2H, m), 3.90 (1H, m), 2.15-2.00 (2H, m), 1.95-1.50 (5H, m), 1.45-1.00 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	532 (M+1)	

表 203

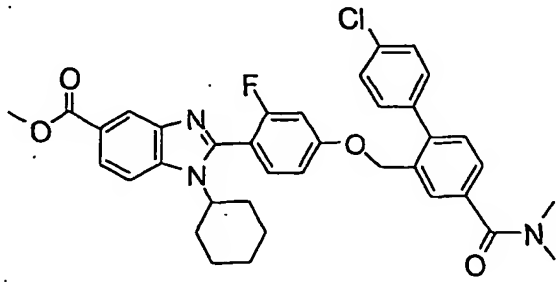
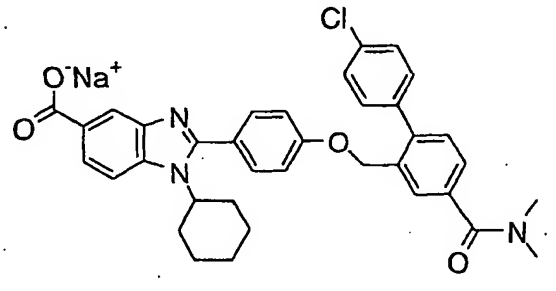
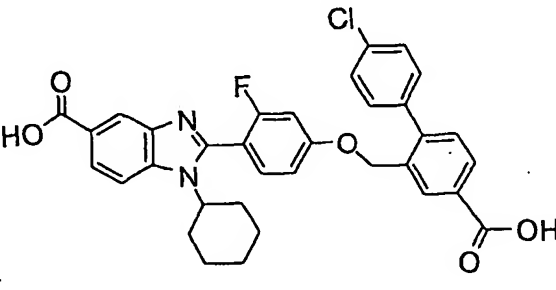
実施例番号	303	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDC13 8.49 (1H, s), 7.98 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.71 (1H, d, J=1.8Hz), 7.66 (1H, d, J=8.6Hz), 7.55-7.29 (7H, m), 6.80 (1H, dd, J=8.2, 2.2Hz), 6.69 (1H, dd, J=11.2, 2.2Hz), 4.99 (2H, s), 4.10-3.92 (1H, m), 3.95 (3H, s), 3.15 (3H, s), 3.06 (3H, s), 2.31-2.14 (2H, m), 2.04-1.86 (4H, m), 1.81-1.71 (1H, m), 1.41-1.21 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	
実施例番号	304	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.21 (1H, s), 7.94 (1H, d, J=8.7Hz), 7.84 (1H, d, J=9.1Hz), 7.70 (1H, s), 7.26-7.39 (9H, m), 7.11 (2H, d, J=8.4Hz), 5.11 (2H, s), 4.26 (1H, m), 3.01 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.38-2.19 (2H, m), 1.97-1.78 (4H, m), 1.72-1.57 (1H, m), 1.48-1.17 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	608 (M+1)	
実施例番号	305	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.24 (2H, s), 8.03 (1H, d, J=8.0Hz), 7.96 (1H, d, J=8.8Hz), 7.87 (1H, d, J=9.1Hz), 7.60-7.46 (6H, m), 7.09 (1H, dd, J=12.0, 1.8Hz), 6.97 (1H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 5.16 (2H, s), 3.97 (1H, m), 2.31-2.11 (2H, m), 1.92-1.73 (4H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.46-1.13 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	599 (M+1)	

表 204

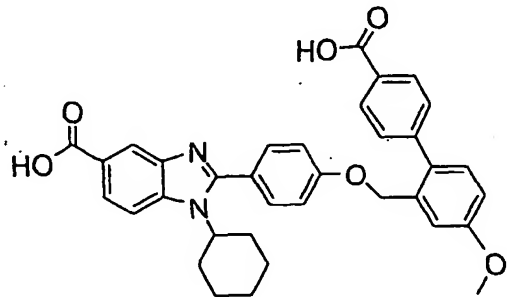
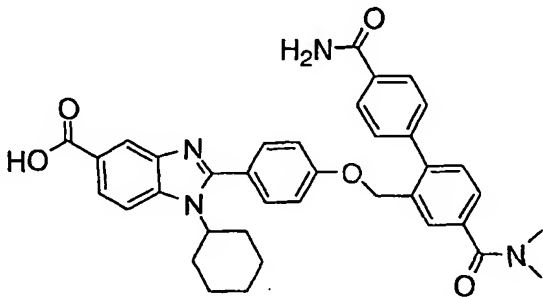
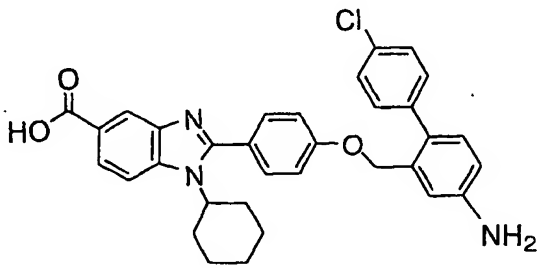
実施例番号	306	$^1\text{H NMR}(\delta)$ ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.84 (1H, brs), 8.21 (1H, s), 7.98-7.84 (5H, m), 7.58 (2H, d, J=8.7Hz), 7.54 (2H, d, J= 7.8Hz), 7.34 (1H, d, J=8.7H z), 7.26 (1H, d, J=2.4Hz), 7. 13-7.06 (3H, m), 5.06 (2H, s) 4.26 (1H, brt, J=12.7Hz), 3 .84 (3H, s), 2.36-2.17 (2H, b rm), 1.99-1.80 (4H, brm), 1. 73-1.59 (1H, brm), 1.47-1.1 7 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	577 (M+1)	
実施例番号	307	$^1\text{H NMR}(\delta)$ ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.22 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7. 96 (2H, d, J=8.1Hz), 7.87 (2H , s), 7.72 (1H, d, J=1.2Hz), 7 .59-7.41 (7H, m), 5.12 (2H, s ), 4.25 (1H, brt, J=11.8Hz), 3.02 (3H, brs), 2.98 (3H, brs ), 2.38-2.15 (2H, brm), 1.93 -1.76 (4H, brm), 1.71-1.59 ( 1H, brm), 1.46-1.16 (3H, brm )
純度	> 90% (NMR)	
MS	617 (M+1)	
実施例番号	308	$^1\text{H NMR}(\delta)$ ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.27 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=9 .0Hz), 7.93 (1H, d, J=8.7Hz) , 7.65 (2H, d, J=8.7Hz), 7.46 (2H, d, J=8.1Hz), 7.42 (2H, d , J=8.4Hz), 7.30-7.04 (5H, m ), 5.03 (2H, s), 4.32 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.05-1.1 0 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	552 (M+1)	

表 205

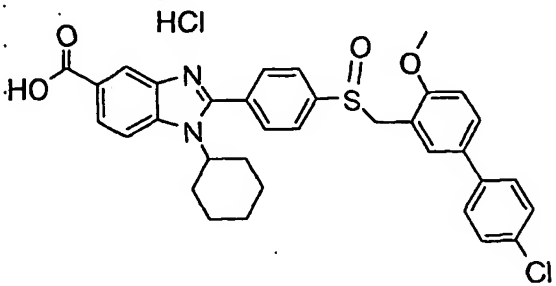
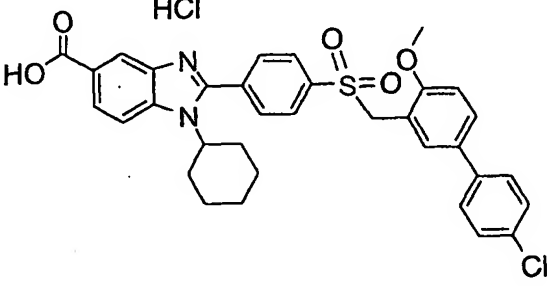
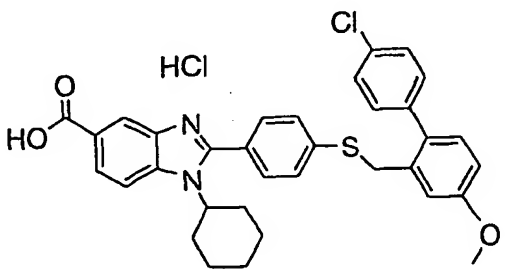
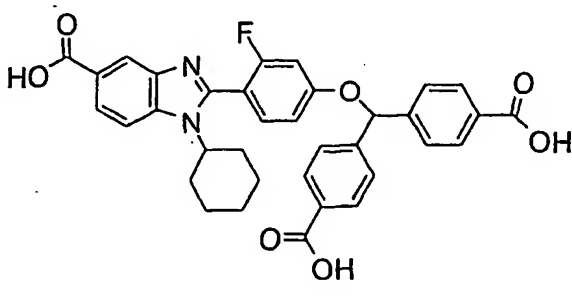
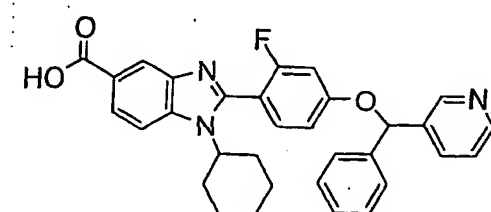
実施例番号	309	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.33 (1H, s), 8.15 and 7.99 (2H, ABq, J=8.9Hz), 7.84 and 7.59 (4H, A'B'q, J=8.3Hz), 7.46 (2H, d, J=8.4Hz), 7.22-7.16 (3H, m), 7.01-6.98 (2H, m), 4.27 and 4.23 (2H, A''B''q, J=12.9Hz), 3.78 (3H, s), 2.39-2.21 (2H, brm), 2.07-1.95 (2H, brm), 1.91-1.80 (2H, brm), 1.72-1.59 (1H, brm), 1.49-1.17 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS		
実施例番号	310	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.33 (1H, s), 8.09 and 7.95 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.87 and 7.71 (4H, A'B'q, J=8.0Hz), 7.43 (2H, d, J=7.8Hz), 7.15 (1H, d, J=8.7Hz), 7.07-7.02 (4H, m), 4.66 (2H, s), 4.23 (1H, brt, J=11.8Hz), 3.76 (3H, s), 2.38-2.20 (2H, brm), 2.04-1.93 (2H, brm), 1.89-1.79 (2H, brm), 1.70-1.59 (1H, brm), 1.49-1.18 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	615 (M+1)	
実施例番号	311	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, s), 8.21 and 8.01 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.52-7.41 (6H, m), 7.20 (1H, d, J=8.4Hz), 7.14 (1H, d, J=2.7Hz), 6.97 (1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 4.31 (1H, brt, J=9.8Hz), 4.28 (2H, s), 3.78 (3H, s), 2.37-2.20 (2H, brm), 2.07-1.95 (2H, brm), 1.92-1.80 (2H, brm), 1.71-1.60 (1H, brm), 1.50-1.19 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	583 (M+1)	

表 206

実施例番号	312	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.22 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=8.4Hz), 8.00-7.84 (5H, m), 7.70 (4H, d, J=8.4Hz), 7.56 (1H, t, J=8.6Hz), 7.23 (1H, d, J=12.0Hz), 7.13 (1H, d, J=8.6Hz), 6.97 (1H, s), 3.92 (1H, m), 2.35-2.00 (2H, m), 1.95-1.70 (4H, m), 1.65-1.55 (1H, m), 1.50-1.05 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	609 (M+1)	

実施例番号	313	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.89 (1H, brs), 8.63 (1H, brs), 8.24 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=7.8Hz), 7.99 (1H, d, J=8.8Hz), 7.89 (1H, d, J=9.9Hz), 7.61-7.55 (4H, m), 7.43 (2H, t, J=7.7Hz), 7.34 (1H, t, J=7.2Hz), 7.24 (1H, d, J=12.0Hz), 7.14 (1H, d, J=8.6Hz), 6.95 (1H, s), 3.96 (1H, m), 2.35-2.05 (2H, m), 2.00-1.50 (5H, m), 1.45-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	522 (M+1)	

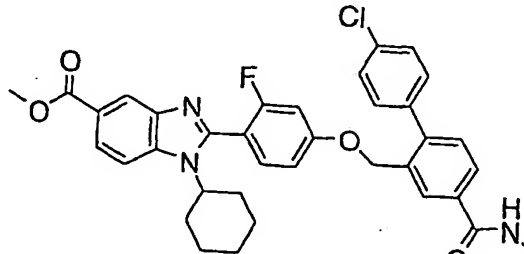
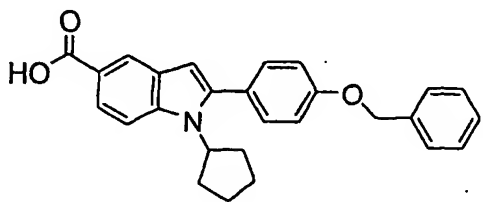
実施例番号	314	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, CDCl <sub>3</sub> 8.48 (1H, d, J=1.4Hz), 8.05 (1H, d, J=1.8Hz), 8.98 (1H, d, J=8.6Hz), 7.82 (1H, d, J=7.9Hz), 7.66 (1H, d, J=8.6Hz), 7.55-7.24 (6H, m), 6.78 (1H, d, J=8.6, 2.6Hz), 6.69 (1H, d, J=11.6Hz), 2.2Hz), 6.40-6.30 (1H, m), 4.99 (2H, s), 4.02 (1H, m), 3.95 (3H, s), 3.05 (3H, d, J=4.8Hz), 2.32-2.13 (2H, m), 2.03-1.87 (4H, m), 1.81-1.71 (1H, m), 1.46-1.23 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	



表 207

実施例番号	503	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.76 (1H, d, J=8.7Hz), 7.58 (1H, d, J=8.8Hz), 7.51-7.32 (7H, m), 7.17 (2H, d, J=8.7Hz), 6.55 (1H, s), 5.18 (2H, s), 4.75 (1H, m), 2.35-2.12 (2H, m), 2.10-1.85 (4H, m), 1.80-1.50 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	412 (M+1)	

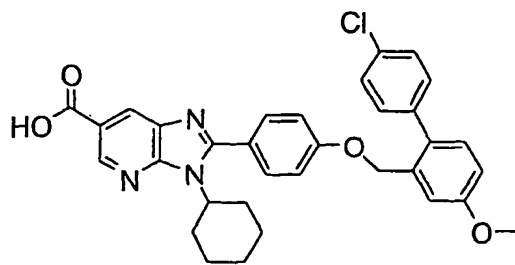
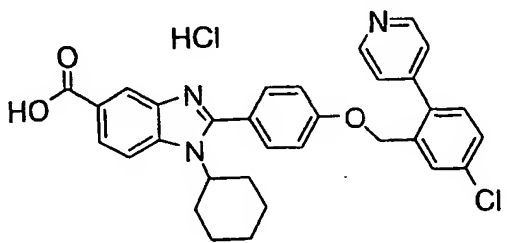
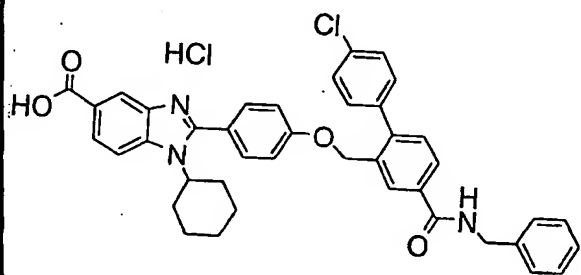
実施例番号	701	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.96 (1H, s), 8.50 (1H, s), 7.77 (2H, d, J=8.7Hz), 7.50-7.40 (4H, m), 7.30 (1H, d, J=8.4Hz), 7.24 (1H, d, J=2.4Hz), 7.16 (2H, d, J=8.4Hz), 7.06 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.1Hz), 5.06 (2H, s), 4.31 (1H, s), 3.83 (3H, s), 2.80-2.55 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.40-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	568 (M+1)	

表 208

実施例番号	315	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.84 (2H, d, J=6.3Hz), 8.28 (1H, s), 8.17 and 7.99 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.87-7.85 (3H, m), 7.70-7.50 (3H, m), 7.52 (1H, d, J=8.3Hz), 7.18 (2H, d, J=8.7Hz), 5.22 (2H, s), 4.31 (1H, br t, J=12.5Hz), 2.36-2.18 (2H, m), 2.03-1.78 (4H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.50-1.23 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	538 (M+1)	

実施例番号	316	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.23 (1H, t, J=6.3Hz), 8.29 (1H, s), 8.25-8.22 (2H, m), 8.03 (2H, d, J=7.9Hz), 7.55-7.48 (5H, m), 7.34 (4H, d, J=4.4Hz), 7.28-7.22 (3H, m), 5.15 (2H, s), 4.52 (2H, d, J=5.9Hz), 4.35 (1H, br t, J=12.1Hz), 2.37-2.18 (2H, m), 2.08-1.95 (2H, m), 1.91-1.79 (2H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.47-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	670 (M+1)	

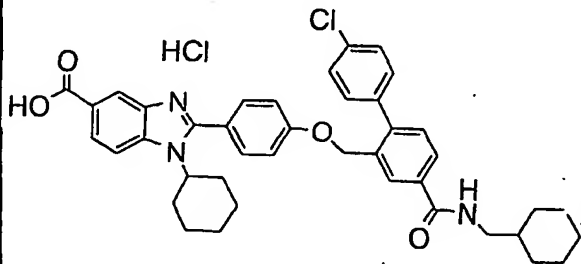
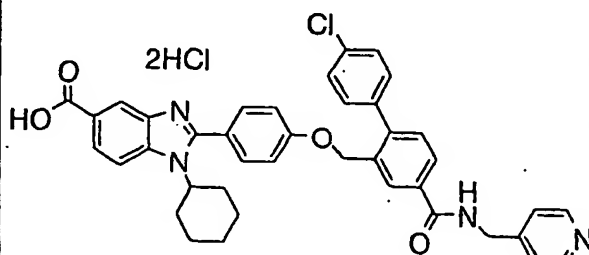
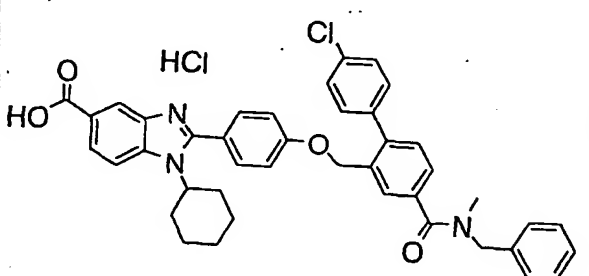
実施例番号	317	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.59 (1H, t, J=5.5Hz), 8.28 (1H, s), 8.21 and 8.01 (2H, ABq, J=8.8Hz), 8.16 (1H, s), 7.97 and 7.46 (2H, A'B'q, J=8.0Hz), 7.71 and 7.23 (4H, A''B''q, J=8.7Hz), 7.53 and 7.49 (4H, A'''B'''q, J=9.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.34 (1H, br t, J=12.8Hz), 3.14 (2H, t, J=6.3Hz), 2.38-2.18 (2H, m), 2.07-1.78 (4H, m), 1.78-1.47 (7H, m), 1.47-1.07 (6H, m), 1.03-0.83 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	676 (M+1)	

表 209

実施例番号	318	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 9.63 (1H, t, J=4.8Hz), 8.86 and 7.97 (4H, ABq, J=6.6Hz), 8.30 (1H, s), 8.27 (1H, s), 8.23 and 8.03 (2H, A'B'q, J=8.8Hz), 8.09 and 7.54 (2H, A''B''q, J=8.1Hz), 7.73 and 7.24 (4H, A'''B'''q, J=8.8Hz), 7.54 and 7.52 (4H, A''''B''''q, J=8.8Hz), 5.16 (2H, s), 4.78 (2H, d, J=5.6Hz), 4.35 (1H, br t, J=11.0Hz), 2.39-2.19 (2H, m), 2.07-1.96 (2H, m), 1.91-1.78 (2H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.50-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	671 (M+1)	

実施例番号	319	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.28 (1H, s), 8.24 and 8.03 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.77 (1H, s), 7.70 (2H, d, J=8.4Hz), 7.64-7.10 (13H, m), 5.16 (2H, s), 4.74 and 4.57 (total 2H, each br s), 4.34 (1H, br t, J=11.7Hz), 2.90 (3H, s), 2.35-2.17 (2H, m), 2.07-1.93 (2H, m), 1.93-1.78 (2H, m), 1.71-1.57 (1H, m), 1.51-1.19 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	684 (M+1)	

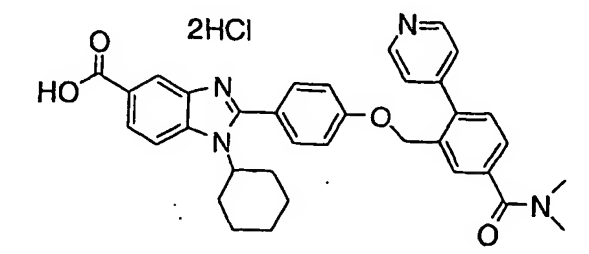
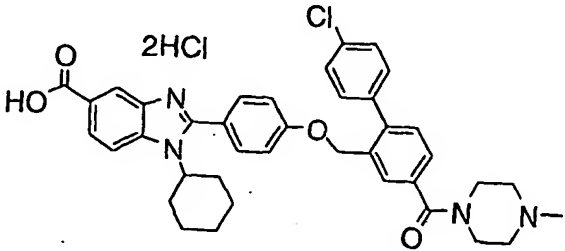
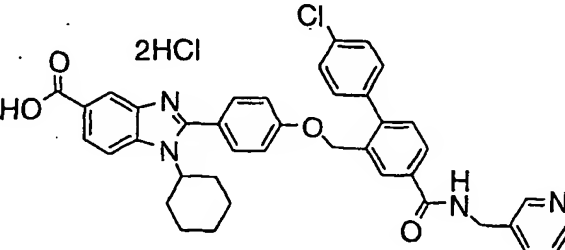
実施例番号	320	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.94 and 8.06 (4H, ABq, J=6.8Hz), 8.33 (1H, s), 8.28 and 8.05 (2H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.80 (1H, s), 7.73 and 7.22 (4H, A''B''q, J=8.7Hz), 7.63 and 7.57 (2H, A'''B'''q, J=7.9Hz), 5.30 (2H, s), 4.34 (1H, br t, J=12.1Hz), 3.04 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.38-2.18 (2H, m), 2.10-1.96 (2H, m), 1.93-1.80 (2H, m), 1.72-1.58 (1H, m), 1.52-1.08 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	575 (M+1)	

表 210

実施例番号	321	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 11.19 (1H, br s), 8.31 (1H, s), 8.23 and 8.02 (2H, ABq, J=9.0Hz), 7.77 (1H, s), 7.72 and 7.23 (4H, A'B'q, J=8.7Hz), 7.59 and 7.48 (2H, A''B''q, J=7.9Hz), 7.53 and 7.51 (4H, A''B''q, J=9.0Hz), 5.16 (2H, s), 4.72-2.97 (8H, br m), 4.34 (1H, br t, J=12.1Hz), 2.79 (3H, s), 2.38-2.17 (2H, m), 2.07-1.93 (2H, m), 1.93-1.78 (2H, m), 1.69-1.58 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	663 (M+1)	

実施例番号	322	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.54 (1H, t, J=5.7Hz), 8.91 (1H, s), 8.81 (1H, d, J=4.9Hz), 8.48 (1H, d, J=7.9Hz), 8.32 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.25 (1H, s), 8.07-7.97 (3H, m), 7.74 and 7.25 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.56-7.49 (5H, m), 5.16 (2H, s), 4.69 (2H, d, J=5.6Hz), 4.36 (1H, br t, J=12.4Hz), 2.37-2.20 (2H, m), 2.09-1.97 (2H, m), 1.91-1.78 (2H, m), 1.70-1.57 (1H, m), 1.50-1.17 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	671 (M+1)	

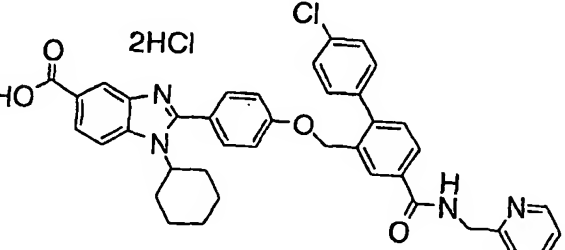
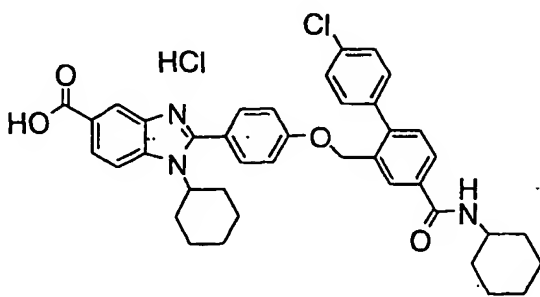
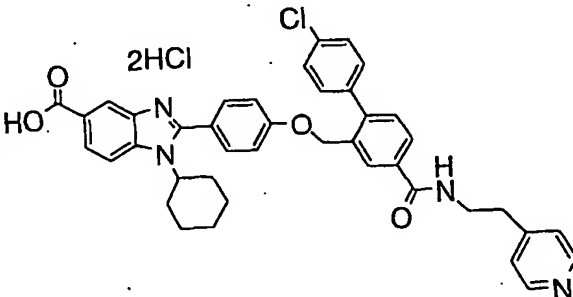
実施例番号	323	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 9.52 (1H, t, J=6.0Hz), 8.72 (1H, d, J=5.3Hz), 8.30-8.19 (4H, m), 8.08 (1H, d, J=7.9Hz), 8.02 (1H, d, J=7.6Hz), 7.77-7.64 (4H, m), 7.57-7.49 (5H, m), 7.24 (2H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.77 (2H, d, J=5.6Hz), 4.34 (1H, t, J=12.8Hz), 2.36-2.19 (2H, m), 2.07-1.95 (2H, m), 1.91-1.78 (2H, m), 1.69-1.59 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	671 (M+1)	

表 211

実施例番号	324	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.36 (1H, d, J=7.9Hz), 8.30 (1H, s), 8.28 and 8.05 (2H, ABq, J=8.8Hz), 8.16 (1H, s), 7.79 and 7.46 (2H, A'B'q, J=8.3Hz), 7.74 and 7.25 (4H, A''B''q, J=8.9Hz), 7.52 and 7.50 (4H, A'''B'''q, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.36 (1H, br t, J=12.1Hz), 3.80 (1H, br s), 2.39-2.18 (2H, m), 2.10-1.98 (2H, m), 1.93-1.57 (8H, m), 1.49-1.04 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	662 (M+1)	

実施例番号	325	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.86 (1H, t, J=6.0Hz), 8.84 and 8.00 (4H, ABq, J=6.6Hz), 8.33 (1H, s), 8.27 and 8.04 (2H, A'B'q, J=9.0Hz), 8.12 (1H, s), 7.92 and 7.46 (2H, A''B''q, J=7.9Hz), 7.74 and 7.23 (4H, A'''B'''q, J=9.0Hz), 7.53 and 7.49 (4H, A''''B''''q, J=9.1Hz), 5.13 (2H, s), 4.36 (1H, br t, J=12.8Hz), 3.70 (2H, td, J=6.8, 6.0Hz), 3.21 (2H, t, J=6.8Hz), 2.38-2.20 (2H, m), 2.09-1.95 (2H, m), 1.91-1.77 (2H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.49-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	685 (M+1)	

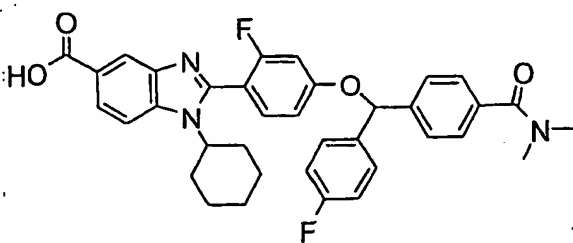
実施例番号	326	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 12.80 (1H, brs), 8.23 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.7Hz), 7.83 (1H, d, J=8.7Hz), 7.60-7.50 (5H, m), 7.39 (2H, d, J=7.8Hz), 7.23-7.10 (3H, m), 7.05 (1H, d, J=7.8Hz), 6.85 (1H, s), 3.94 (1H, s), 2.97, 2.88 (6H, s), 2.30-2.10 (2H, m), 1.90-1.50 (5H, m), 1.40-1.00 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	610 (M+1)	

表 212

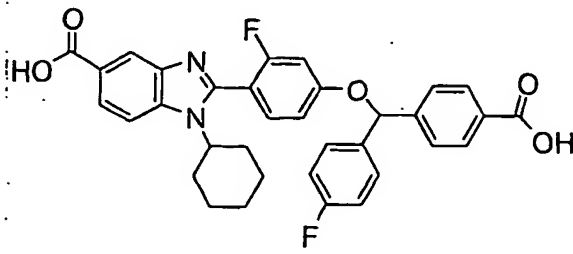
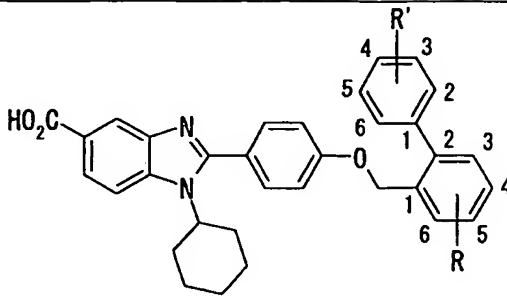
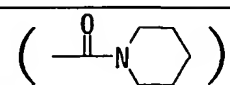
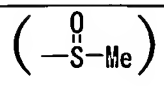
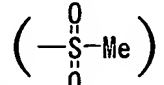
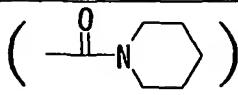
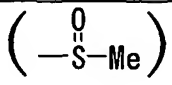
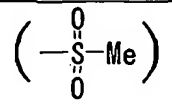
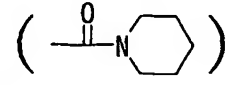
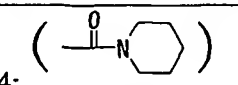
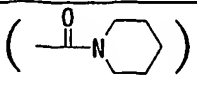
実施例番号	327	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 13.20-12.60 (2H, brs), 8.23 (1H, s), 7.98 (2H, d, J=6.6Hz), 7.95 (1H, d, J=8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.70-7.50 (5H, m), 7.27-7.20 (3H, m), 7.08 (1H, d, J=7.8Hz), 6.90 (1H, s), 3.93 (1H, s), 2.51-2.05 (2H, m), 1.90-1.70 (4H, m), 1.65-1.55 (1H, m), 1.40-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	583 (M+1)	

表 213

		
実施例 番号	R	R'
2001	-H	4-(·Me)
2002	-H	3-(·CF <sub>3</sub> )
2003	5-(·F)	-H
2004	3-(·F)	2-(·F)
2005	3-(·F)	3-(·F)
2006	3-(·F)	4-(·F)
2007	4-(·F)	4-(·F)
2008	5-(·F)	4-(·F)
2009	6-(·F)	4-(·F)
2010	4-(·F)	4-(·Cl)
2011	5-(·F)	4-(·Me)
2012	5-(·F)	4-(·CF <sub>3</sub> )
2013	5-(·F)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2014	5-(·F)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2015	5-(·F)	4-(  )
2016	5-(·F)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2017	5-(·F)	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2018	5-(·F)	4-(·OMe)
2019	5-(·F)	4-(·SMe)
2020	5-(·F)	4-(  )
2021	5-(·F)	4-(  )
2022	4-(·Cl)	-H
2023	4-(·Cl)	4-(·F)

2024	4-(·Cl)	4-(·Cl)
2025	4-(·Cl)	4-(·Me)
2026	5-(·Cl)	4-(·CF <sub>3</sub> )
2027	4-(·Cl)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2028	5-(·Cl)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2029	5-(·Cl)	4- (  )
2030	4-(·Cl)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2031	5-(·Cl)	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2032	5-(·Cl)	3-(·OMe)
2033	4-(·Cl)	4-(·SMe)
2034	5-(·Cl)	4- (  )
2035	4-(·Cl)	4- (  )
2036	5-(·CN)	4-(·F)
2037	4-(·CN)	4-(·Cl)
2038	5-(·NO <sub>2</sub> )	4-(·F)
2039	4-(·NO <sub>2</sub> )	4-(·Cl)
2040	5-(·Me)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2041	5-(·Me)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2042	5-(·Me)	4- (  )
2043	5-(·CF <sub>3</sub> )	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2044	5-(·CF <sub>3</sub> )	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2045	5-(·CF <sub>3</sub> )	4- (  )
2046	5-(·CO <sub>2</sub> H)	4-(·F)
2047	4-(·CO <sub>2</sub> H)	4-(·Cl)
2048	5-(·CO <sub>2</sub> Me)	4-(·F)
2049	5-(·CO <sub>2</sub> Me)	4-(·Cl)
2050	5-(·Ac)	4-(·F)
2051	5-(·Ac)	4-(·Cl)
2052	5- (  )	·H



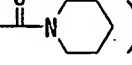
2053	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-F)
2054	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-Cl)
2055	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CN)
2056	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-NO <sub>2</sub> )
2057	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-Me)
2058	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CF <sub>3</sub> )
2059	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-Ac)
2060	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CO <sub>2</sub> H)
2061	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CO <sub>2</sub> Me)
2062	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$
2063	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CONH <sub>2</sub> )
2064	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-{-CON(Me) <sub>2</sub> }
2065	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-{-C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2066	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-OMe)
2067	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \text{O---CH}_2 \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$
2068	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-NHMe)
2069	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-NHAc)
2070	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \text{N} \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$

2071	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-SMe)
2072	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$
2073	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$
2074	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{NH}_2 \right)$
2075	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left\{ \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{N}(\text{Me})_2 \right\}$
2076	5-(-CONH <sub>2</sub> )	-H
2077	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-F)
2078	5-(-CONH <sub>2</sub> )	2,3,4,5,6-penta-(-F)
2079	5-(-CONH <sub>2</sub> )	2-(-Cl)
2080	5-(-CONH <sub>2</sub> )	3-(-Cl)
2081	3-(-CONH <sub>2</sub> )	2-(-Cl)
2082	3-(-CONH <sub>2</sub> )	3-(-Cl)
2083	3-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-Cl)
2084	4-(-CONH <sub>2</sub> )	2-(-Cl)
2085	4-(-CONH <sub>2</sub> )	3-(-Cl)
2086	4-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-Cl)
2087	6-(-CONH <sub>2</sub> )	2-(-Cl)
2088	6-(-CONH <sub>2</sub> )	3-(-Cl)
2089	6-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-Cl)
2090	5-(-CONH <sub>2</sub> )	3,5-di-(-Cl)
2091	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-CN)
2092	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-NO <sub>2</sub> )
2093	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-Me)
2094	5-(-CONH <sub>2</sub> )	2,6-di-(-Me)
2095	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-CF <sub>3</sub> )
2096	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-Ac)
2097	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-CO <sub>2</sub> H)
2098	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-CO <sub>2</sub> Me)
2099	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$
2100	5-(-CONH <sub>2</sub> )	4-(-CONH <sub>2</sub> )

2101	5-(·CONH <sub>2</sub> )	3,5-di-(·CONH <sub>2</sub> )
2102	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2103	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2104	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·OMe)
2105	5-(·CONH <sub>2</sub> )	3,4,5-tri-(·OMe)
2106	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4- $\left( -O-CH_2-\overset{O}{\parallel}N-\text{C}_6\text{H}_{11} \right)$
2107	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·NHMe)
2108	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·NHAc)
2109	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4- $\left( -\overset{O}{\parallel}N-\overset{O}{\parallel}S-\text{Me} \right)$
2110	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·SMe)
2111	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4- $\left( -\overset{O}{\parallel}S-\text{Me} \right)$
2112	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4- $\left( -\overset{O}{\parallel}S-\text{Me} \right)$
2113	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4- $\left( -\overset{O}{\parallel}S-\text{NH}_2 \right)$
2114	5-(·CONH <sub>2</sub> )	4- $\left\{ -\overset{O}{\parallel}S-\text{N}(\text{Me})_2 \right\}$
2115	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	-H
2116	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·F)
2117	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Cl)
2118	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CN)
2119	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·NO <sub>2</sub> )
2120	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Me)
2121	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CF <sub>3</sub> )
2122	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Ac)
2123	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2124	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2125	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4- $\left( -\overset{O}{\parallel}N-\text{C}_6\text{H}_{11} \right)$
2126	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	3-(·CONH <sub>2</sub> )
2127	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2128	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }

2129	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·OMe)
2130	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4· $\left( -O-CH_2-\overset{\overset{O}{\parallel}}{N}-\text{C}_6\text{H}_{11} \right)$
2131	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·NHMe)
2132	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·NHAc)
2133	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4· $\left( -N-\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$
2134	4-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·SMe)
2135	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4· $\left( -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$
2136	4-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4· $\left( -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$
2137	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4· $\left( -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-NH_2 \right)$
2138	5-{CON(Me) <sub>2</sub> }	4· $\left\{ -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-N(Me)_2 \right\}$
2139	5-(·OMe)	·H
2140	5-(·OMe)	4-(·F)
2141	3-(·OMe)	4-(·Cl)
2142	4-(·OMe)	4-(·Cl)
2143	5-(·OMe)	2-(·Cl)
2144	5-(·OMe)	3-(·Cl)
2145	6-(·OMe)	4-(·Cl)
2146	5-(·OMe)	4-(·CN)
2147	5-(·OMe)	4-(·NO <sub>2</sub> )
2148	5-(·OMe)	4-(·Me)
2149	5-(·OMe)	4-(·CF <sub>3</sub> )
2150	5-(·OMe)	4-(·Ac)
2151	4-(·OMe)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2152	4,5-di-(·OMe)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2153	5-(·OMe)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2154	5-(·OMe)	4· $\left( -\overset{\overset{O}{\parallel}}{N}-\text{C}_6\text{H}_{11} \right)$
2155	5-(·OMe)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2156	5-(·OMe)	4-{CON(Me) <sub>2</sub> }

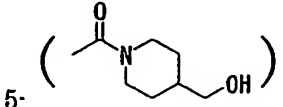
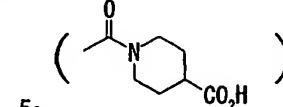
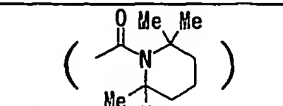
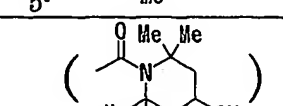
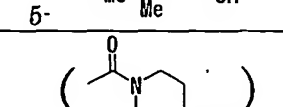
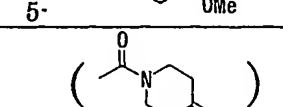
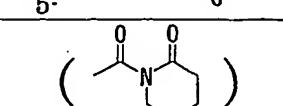
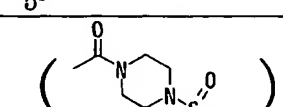
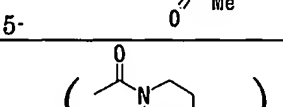
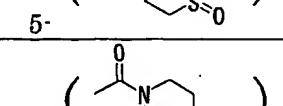
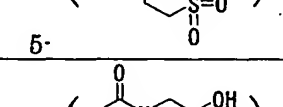
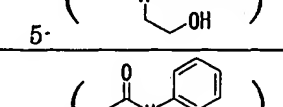
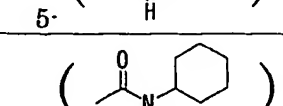
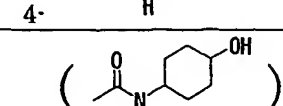
2157	5-(·OMe)	4-{·C(=NHNH <sub>2</sub> )}
2158	5-(·OMe)	4-(·OMe)
2159	5-(·OMe)	4- $\left( -O-CH_2-\overset{\overset{O}{\parallel}}{N}-\text{C}_6\text{H}_{11} \right)$
2160	5-(·OMe)	4-(·NHMe)
2161	5-(·OMe)	4-(·NHAc)
2162	5-(·OMe)	4- $\left( -\underset{\underset{H}{ }}{N}-\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$
2163	5-(·OMe)	4-(·SMe)
2164	5-(·OMe)	4- $\left( -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$
2165	5-(·OMe)	4- $\left( -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$
2166	5-(·OMe)	4- $\left( -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-NH_2 \right)$
2167	5-(·OMe)	4- $\left\{ -\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-N(Me)_2 \right\}$
2168	5-(·NHMe)	4-(·F)
2169	5-(·NHMe)	4-(·Cl)
2170	5-(·NHAc)	4-(·F)
2171	5-(·NHAc)	4-(·Cl)
2172	5-(·NHAc)	4-(·Ac)
2173	5-(·NHAc)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2174	5-(·NHAc)	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2175	5- $\left( -\underset{\underset{H}{ }}{N}-\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$	4-(·F)
2176	4- $\left( -\underset{\underset{H}{ }}{N}-\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$	4-(·Cl)
2177	5- $\left( -\underset{\underset{H}{ }}{N}-\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$	4-(·Me)
2178	5- $\left( -\underset{\underset{H}{ }}{N}-\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2179	5- $\left( -\underset{\underset{H}{ }}{N}-\overset{\overset{O}{\parallel}}{S}-Me \right)$	4-(·CO <sub>2</sub> H)

2180	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\   \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \\ \text{H} \end{array} \right)$	4-(-CO <sub>2</sub> Me)
2181	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\   \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{N} \end{array} \right)$ 
2182	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\   \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(-SMe)
2183	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\   \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$
2184	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\   \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \\    \\ \text{O} \end{array} \right)$
2185	5-(-SMe)	4-(-F)
2186	4-(-SMe)	4-(-Cl)
2187	5-(-SMe)	4-(-Me)
2188	5-(-SMe)	4-(-CF <sub>3</sub> )
2189	5-(-SMe)	4-(-Ac)
2190	5-(-SMe)	4-(-CONH <sub>2</sub> )
2191	5-(-SMe)	4-{-CON(Me) <sub>2</sub> }
2192	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(-F)
2193	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(-Cl)
2194	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(-Me)
2195	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(-CF <sub>3</sub> )
2196	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(-Ac)
2197	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(-CONH <sub>2</sub> )
2198	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-{-CON(Me) <sub>2</sub> }
2199	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \\    \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(-F)
2200	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \\    \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(-Cl)
2201	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{Me} \\    \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(-Me)

2202	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---Me} \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2203	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---Me} \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·Ac)
2204	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---Me} \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2205	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---Me} \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2206	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·F)
2207	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 4\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·Cl)
2208	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 4\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	2,4-di-(·Cl)
2209	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·Me)
2210	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	3-(·CF <sub>3</sub> )
2211	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2212	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2213	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2214	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·SMe)
2215	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	$4\text{-} \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2216	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left( \text{---S---NH}_2 \right) \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	$4\text{-} \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2217	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 5\text{-} \left\{ \text{---S---N(Me)}_2 \right\} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·F)
2218	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ 4\text{-} \left\{ \text{---S---N(Me)}_2 \right\} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	4-(·Cl)

2219	5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4-(·Me)
2220	5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2221	5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2222	5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2223	5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4-(·SMe)
2224	5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2225	5- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2226	5-{·O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH}	4-(·Cl)
2227	5-{·O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH}	4-(·Cl)
2228	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{Cyclohexyl} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2229	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{Pyridin-2-yl} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2230	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{2-Methylthiazol-5-yl} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2231	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{4-Hydroxypiperidin-1-yl} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2232	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{N-(4-Hydroxypiperidin-1-yl)acetamide} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2233	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{N-(2-Hydroxy-1-methylpyrrolidin-1-yl)acetamide} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2234	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{N-(4-Hydroxypiperidin-1-yl)acetamide} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2235	5- $\left( \begin{array}{c} \text{---O---} \text{N-(2,6-Dihydroxypiperidin-1-yl)acetamide} \end{array} \right)$	4-(·Cl)



2236	5- 	4-(Cl)
2237	5- 	4-(Cl)
2238	5- 	4-(Cl)
2239	5- 	4-(Cl)
2240	5- 	4-(Cl)
2241	5- 	4-(Cl)
2242	5- 	4-(Cl)
2243	5- 	4-(Cl)
2244	5- 	4-(Cl)
2245	5- 	4-(Cl)
2246	5- 	4-(Cl)
2247	5- 	4-(Cl)
2248	4- 	4-(Cl)
2249	5- 	4-(Cl)

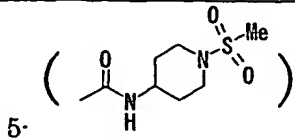
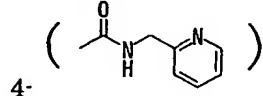
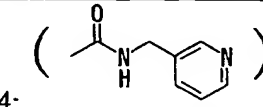
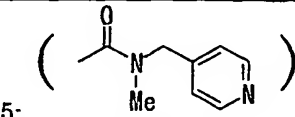
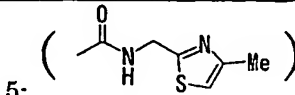
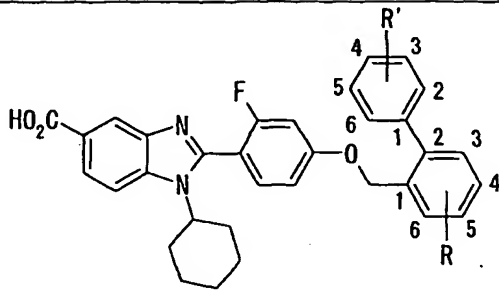
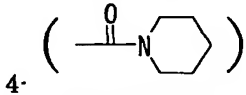
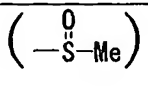
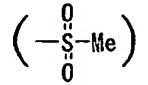
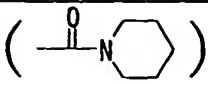
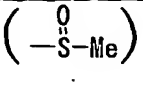
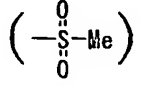
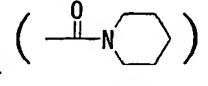
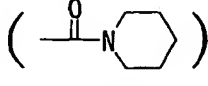
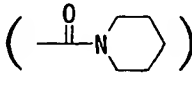
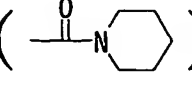
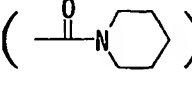
2250	 5-	4-(-Cl)
2251	 4-	4-(-Cl)
2252	 4-	4-(-Cl)
2253	 5-	4-(-Cl)
2254	 5-	4-(-Cl)

表 214

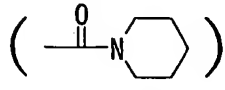
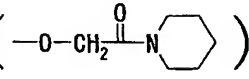
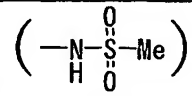
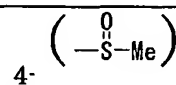
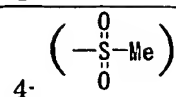
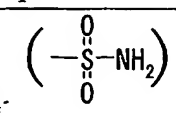
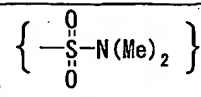
		
実施例 番号	R	R'
2255	-H	-H
2256	-H	4-(Me)
2257	-H	3-(CF <sub>3</sub> )
2258	5-(F)	-H
2259	5-(F)	4-(F)
2260	5-(F)	4-(Cl)
2261	5-(F)	4-(Me)
2262	5-(F)	4-(CF <sub>3</sub> )
2263	5-(F)	4-(CO <sub>2</sub> H)
2264	5-(F)	4-(CO <sub>2</sub> Me)
2265	5-(F)	4-(  )
2266	5-(F)	4-(CONH <sub>2</sub> )
2267	5-(F)	4-{CON(Me) <sub>2</sub> }
2268	5-(F)	4-(OMe)
2269	5-(F)	4-(SMe)
2270	5-(F)	4-(  )
2271	5-(F)	4-(  )
2272	4-(Cl)	-H
2273	5-(Cl)	4-(F)
2274	4-(Cl)	4-(Cl)
2275	5-(Cl)	4-(Me)
2276	5-(Cl)	4-(CF <sub>3</sub> )
2277	5-(Cl)	4-(CO <sub>2</sub> H)

2278	5-(·Cl)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2279	5-(·Cl)	4-(  )
2280	5-(·Cl)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2281	5-(·Cl)	4-(·CON(Me) <sub>2</sub> )
2282	5-(·Cl)	4-(·OMe)
2283	5-(·Cl)	4-(·SMe)
2284	5-(·Cl)	4-(  )
2285	5-(·Cl)	4-(  )
2286	5-(·CN)	4-(·F)
2287	5-(·CN)	4-(·Cl)
2288	5-(·NO <sub>2</sub> )	4-(·F)
2289	5-(·NO <sub>2</sub> )	4-(·Cl)
2290	5-(·Me)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2291	5-(·Me)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2292	5-(·Me)	4-(  )
2293	5-(·CF <sub>3</sub> )	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2294	5-(·CF <sub>3</sub> )	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2295	5-(·CF <sub>3</sub> )	4-(  )
2296	5-(·CO <sub>2</sub> H)	4-(·F)
2297	4-(·CO <sub>2</sub> H)	4-(·Cl)
2298	5-(·CO <sub>2</sub> Me)	4-(·F)
2299	5-(·CO <sub>2</sub> Me)	4-(·Cl)
2300	5-(·Ac)	4-(·F)
2301	5-(·Ac)	4-(·Cl)
2302	5-(  )	·H
2303	5-(  )	4-(·F)
2304	4-(  )	4-(·Cl)


2305	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CN)
2306	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-NO <sub>2</sub> )
2307	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-Me)
2308	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CF <sub>3</sub> )
2309	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-Ac)
2310	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CO <sub>2</sub> H)
2311	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CO <sub>2</sub> Me)
2312	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$
2313	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-CONH <sub>2</sub> )
2314	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-{-CON(Me) <sub>2</sub> }
2315	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-{-C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2316	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-OMe)
2317	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---O---CH}_2\text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$
2318	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-NHMe)
2319	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-NHAc)
2320	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$
2321	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4-(-SMe)
2322	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$

2323	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$
2324	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{NH}_2 \right)$
2325	5- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$	4- $\left\{ \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{N}(\text{Me})_2 \right\}$
2326	5- $(\text{---CONH}_2)$	$\cdot \text{H}$
2327	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\cdot \text{F})$
2328	4- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\cdot \text{Cl})$
2329	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\cdot \text{CN})$
2330	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\cdot \text{NO}_2)$
2331	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\cdot \text{Me})$
2332	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\cdot \text{CF}_3)$
2333	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\cdot \text{Ac})$
2334	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\text{---CO}_2\text{H})$
2335	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\text{---CO}_2\text{Me})$
2336	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$
2337	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\text{---CONH}_2)$
2338	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\{ \text{---CON}(\text{Me})_2 \}$
2339	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\{ \text{---C}(\text{=NH})\text{NH}_2 \}$
2340	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\text{---OMe})$
2341	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\left( \text{---O---CH}_2 \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{N} \text{---} \right)$
2342	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\text{---NHMe})$
2343	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\text{---NHAc})$
2344	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\left( \text{---N} \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$
2345	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $(\text{---SMe})$
2346	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$
2347	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{Me} \right)$
2348	5- $(\text{---CONH}_2)$	4- $\left( \text{---} \overset{\text{O}}{\parallel} \text{S} \text{---} \text{NH}_2 \right)$

2349	5-(·CONH <sub>2</sub> )	$4\cdot \left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$
2350	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	·H
2351	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·F)
2352	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Cl)
2353	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CN)
2354	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·NO <sub>2</sub> )
2355	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Me)
2356	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CF <sub>3</sub> )
2357	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Ac)
2358	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2359	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2360	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \end{array} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$
2361	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2362	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2363	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2364	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·OMe)
2365	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{O}-\text{CH}_2-\text{N} \end{array} \text{C}_6\text{H}_{11} \right)$
2366	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·NHMe)
2367	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·NHAc)
2368	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$
2369	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·SMe)
2370	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2371	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2372	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2373	5-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	$4\cdot \left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$
2374	5-(·OMe)	·H

2375	5-(·OMe)	4-(·F)
2376	5-(·OMe)	4-(·Cl)
2377	5-(·OMe)	4-(·CN)
2378	5-(·OMe)	4-(·NO <sub>2</sub> )
2379	5-(·OMe)	4-(·Me)
2380	5-(·OMe)	4-(·CF <sub>3</sub> )
2381	5-(·OMe)	4-(·Ac)
2382	5-(·OMe)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2383	5-(·OMe)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2384	5-(·OMe)	4- 
2385	5-(·OMe)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2386	5-(·OMe)	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2387	5-(·OMe)	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2388	5-(·OMe)	4-(·OMe)
2389	5-(·OMe)	4- 
2390	5-(·OMe)	4-(·NHMe)
2391	5-(·OMe)	4-(·NHAc)
2392	5-(·OMe)	4- 
2393	5-(·OMe)	4-(·SMe)
2394	5-(·OMe)	4- 
2395	5-(·OMe)	4- 
2396	5-(·OMe)	4- 
2397	5-(·OMe)	4- 
2398	5-(·NHMe)	4-(·F)
2399	5-(·NHMe)	4-(·Cl)
2400	5-(·NHAc)	4-(·F)
2401	5-(·NHAc)	4-(·Cl)
2402	5-(·NHAc)	4-(·Ac)

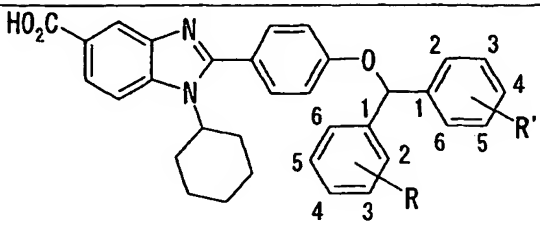
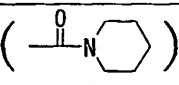
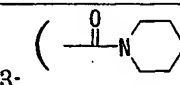
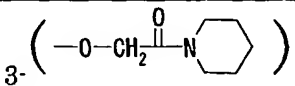
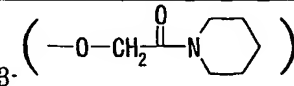
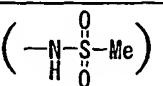
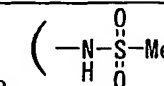


2403	5-(·NHAc)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2404	5-(·NHAc)	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2405	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4-(·F)
2406	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2407	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4-(·Me)
2408	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2409	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2410	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2411	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \end{array} \right)$ 
2412	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4-(·SMe)
2413	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$
2414	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$
2415	5-(·SMe)	4-(·F)
2416	5-(·SMe)	4-(·Cl)
2417	5-(·SMe)	4-(·Me)
2418	5-(·SMe)	4-(·CF <sub>3</sub> )
2419	5-(·SMe)	4-(·Ac)
2420	5-(·SMe)	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2421	5-(·SMe)	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2422	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(·F)
2423	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2424	5- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(·Me)

2425	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2426	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(·Ac)
2427	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2428	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2429	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·F)
2430	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2431	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·Me)
2432	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2433	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·Ac)
2434	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2435	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2436	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·F)
2437	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·Cl)
2438	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·Me)
2439	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·CF <sub>3</sub> )
2440	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2441	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2442	$5\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	4-(·SMe)

2443	$5\text{-}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right)$	$4\text{-}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right)$
2444	$5\text{-}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right)$	$4\text{-}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right)$
2445	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-(}\cdot\text{F)}$
2446	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-(}\cdot\text{Cl)}$
2447	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-(}\cdot\text{Me)}$
2448	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-(}\cdot\text{CF}_3)$
2449	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-(}\cdot\text{CONH}_2)$
2450	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-(}\cdot\text{CON(Me)}_2)$
2451	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-(}\cdot\text{SMe)}$
2452	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right)$
2453	$5\text{-}\left\{\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---N(Me)}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right\}$	$4\text{-}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}\right)$

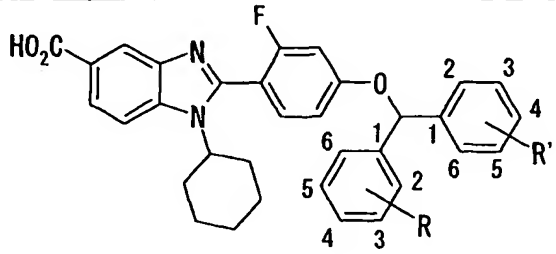
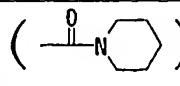
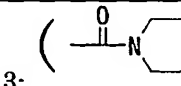
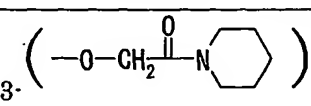
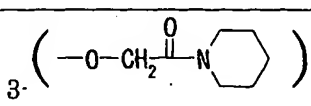
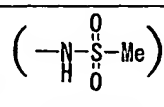
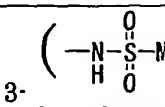
表 215

		
実施例 番号	R	R'
2454	2-(F)	2-(F)
2455	2-(F)	3-(F)
2456	2-(F)	4-(F)
2457	3-(Cl)	3-(Cl)
2458	3,5-di-(Cl)	3,5-di-(Cl)
2459	3-(CN)	3-(CN)
2460	3-(NO <sub>2</sub> )	3-(NO <sub>2</sub> )
2461	3-(Me)	3-(Me)
2462	3-(CF <sub>3</sub> )	3-(CF <sub>3</sub> )
2463	3-(Ac)	3-(Ac)
2464	3-(CO <sub>2</sub> H)	3-(CO <sub>2</sub> H)
2465	3-(CO <sub>2</sub> Me)	3-(CO <sub>2</sub> Me)
2466	3-(  )	3-(  )
2467	3-(CONH <sub>2</sub> )	3-(CONH <sub>2</sub> )
2468	3-(CONH <sub>2</sub> )	3-(F)
2469	3-(CONH <sub>2</sub> )	3-(Cl)
2470	3-{CON(Me) <sub>2</sub> }	3-{CON(Me) <sub>2</sub> }
2471	3-{CON(Me) <sub>2</sub> }	3-(F)
2472	3-{CON(Me) <sub>2</sub> }	3-(Cl)
2473	3-{C(=NH)NH <sub>2</sub> }	3-{C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2474	3-(OMe)	3-(OMe)
2475	3-(  )	3-(  )
2476	3-(NHMe)	3-(NHMe)
2477	3-(NHAc)	3-(NHAc)
2478	3-(  )	3-(  )

2479	3-(·SMe)	3-(·SMe)
2480	$3-\left(\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{Me}\right)$	$3-\left(\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{Me}\right)$
2481	$3-\left(\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{Me}\right)$	$3-\left(\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{Me}\right)$
2482	$3-\left(\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{NH}_2\right)$	$3-\left(\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{NH}_2\right)$
2483	$3-\left\{\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{N}(\text{Me})_2\right\}$	$3-\left\{\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}-\text{N}(\text{Me})_2\right\}$
2484	3-(·F)	4-(·F)
2485	3-(·Cl)	4-(·Cl)
2486	4-(·CN)	4-(·CN)
2487	4-(·NO <sub>2</sub> )	4-(·NO <sub>2</sub> )
2488	3-(·Me)	4-(·Me)
2489	4-(·Me)	2,6-di-(·Me)
2490	4-(·CF <sub>3</sub> )	4-(·CF <sub>3</sub> )
2491	4-(·Ac)	4-(·Ac)
2492	4-(·CO <sub>2</sub> H)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2493	4-(·CO <sub>2</sub> Me)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2494	$4-\left(\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{N}\right)$	$4-\left(\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{N}\right)$
2495	4-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2496	4-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·F)
2497	4-(·CONH <sub>2</sub> )	2,3,4,5,6-penta-(·F)
2498	4-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·Cl)
2499	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2500	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·F)
2501	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Cl)
2502	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	3,5-di-(·Cl)
2503	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2504	4-(·OMe)	4-(·OMe)
2505	4-(·OMe)	3,4,5-tri-(·OMe)
2506	$4-\left(\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{N}\right)$	$4-\left(\text{O}-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\text{C}}-\text{N}\right)$
2507	4-(·NHMe)	4-(·NHMe)

2508	4-(NHAc)	4-(NHAc)
2509	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{N} \cdot \text{S} \cdot \text{Me} \\   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{N} \cdot \text{S} \cdot \text{Me} \\   \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$
2510	4-(SMe)	4-(SMe)
2511	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S} \cdot \text{Me} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S} \cdot \text{Me} \end{array} \right)$
2512	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S} \cdot \text{Me} \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \cdot \text{S} \cdot \text{Me} \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$
2513	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \cdot \text{S} \cdot \text{NH}_2 \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$	4- $\left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \cdot \text{S} \cdot \text{NH}_2 \\   \\ \text{O} \end{array} \right)$
2514	4- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S} \cdot \text{N}(\text{Me})_2 \\   \\ \text{O} \end{array} \right\}$	4- $\left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \cdot \text{S} \cdot \text{N}(\text{Me})_2 \\   \\ \text{O} \end{array} \right\}$

表 216

		
実施例 番号	R	R'
2515	-H	-H
2516	2-(·F)	3-(·F)
2517	3-(·Cl)	3-(·Cl)
2518	3-(·CN)	3-(·CN)
2519	3-(·NO <sub>2</sub> )	3-(·NO <sub>2</sub> )
2520	3-(·Me)	3-(·Me)
2521	3-(·CF <sub>3</sub> )	3-(·CF <sub>3</sub> )
2522	3-(·Ac)	3-(·Ac)
2523	3-(·CO <sub>2</sub> H)	3-(·CO <sub>2</sub> H)
2524	3-(·CO <sub>2</sub> Me)	3-(·CO <sub>2</sub> Me)
2525	3-(  )	3-(  )
2526	3-(·CONH <sub>2</sub> )	3-(·CONH <sub>2</sub> )
2527	3-(·CONH <sub>2</sub> )	3-(·F)
2528	3-(·CONH <sub>2</sub> )	3-(·Cl)
2529	3-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	3-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2530	3-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	3-(·F)
2531	3-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	3-(·Cl)
2532	3-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }	3-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2533	3-(·OMe)	3-(·OMe)
2534	3-(  )	3-(  )
2535	3-(·NHMe)	3-(·NHMe)
2536	3-(·NHAc)	3-(·NHAc)
2537	3-(  )	3-(  )
2538	3-(·SMe)	3-(·SMe)

2539	$3\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	$3\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$
2540	$3\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	$3\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2541	$3\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$	$3\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right)$
2542	$3\cdot \left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$	$3\cdot \left\{ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{N}(\text{Me})_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \right\}$
2543	3-(·F)	4-(·F)
2544	4-(·Cl)	4-(·Cl)
2545	4-(·CN)	4-(·CN)
2546	4-(·NO <sub>2</sub> )	4-(·NO <sub>2</sub> )
2547	4-(·Me)	4-(·Me)
2548	4-(·CF <sub>3</sub> )	4-(·CF <sub>3</sub> )
2549	4-(·Ac)	4-(·Ac)
2550	3-(·CO <sub>2</sub> H)	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2551	4-(·CO <sub>2</sub> Me)	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2552	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \end{array} \right)$	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \end{array} \right)$
2553	4-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2554	4-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·F)
2555	4-(·CONH <sub>2</sub> )	4-(·Cl)
2556	3-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2557	3-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·F)
2558	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }	4-(·Cl)
2559	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }	4-{·C(=NH)NH <sub>2</sub> }
2560	4-(·OMe)	4-(·OMe)
2561	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{O}-\text{CH}_2-\text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \end{array} \right)$	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{O}-\text{CH}_2-\text{N} \text{---} \text{C}_6\text{H}_{11} \end{array} \right)$
2562	4-(·NHMe)	4-(·NHMe)
2563	4-(·NHAc)	4-(·NHAc)
2564	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{S}-\text{Me} \\ \parallel \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array} \right)$
2565	4-(·SMe)	4-(·SMe)
2566	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$	$4\cdot \left( \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{S}-\text{Me} \end{array} \right)$



2567	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{4-} \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{4-} \text{---S---Me} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$
2568	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{4-} \text{---S---NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{4-} \text{---S---NH}_2 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$
2569	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{4-} \left\{ \text{---S---N(Me)}_2 \right\} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{4-} \left\{ \text{---S---N(Me)}_2 \right\} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$

表 217

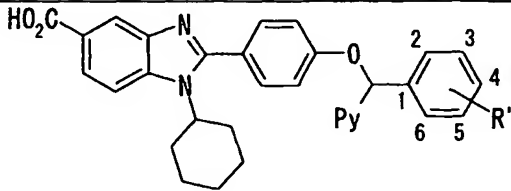
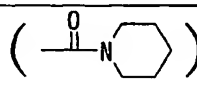
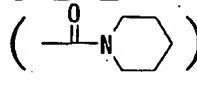
		
Py: ピリジル基		
実施例 番号	Py	R'
2570	3-Py	-H
2571	3-Py	3-(F)
2572	3-Py	3-(Cl)
2573	3-Py	3-(Me)
2574	3-Py	3-(CF <sub>3</sub> )
2575	3-Py	3-(Ac)
2576	3-Py	3-(CO <sub>2</sub> H)
2577	3-Py	3-(CO <sub>2</sub> Me)
2578	3-Py	3-(  )
2579	3-Py	3-(CONH <sub>2</sub> )
2580	3-Py	3-{CON(Me) <sub>2</sub> }
2581	3-Py	4-(F)
2582	3-Py	4-(Cl)
2583	3-Py	4-(Me)
2584	3-Py	4-(CF <sub>3</sub> )
2585	3-Py	4-(Ac)
2586	2-Py	4-(CO <sub>2</sub> H)
2587	3-Py	4-(CO <sub>2</sub> Me)
2588	3-Py	4-(  )
2589	4-Py	4-(CONH <sub>2</sub> )
2590	3-Py	4-{CON(Me) <sub>2</sub> }

表 218

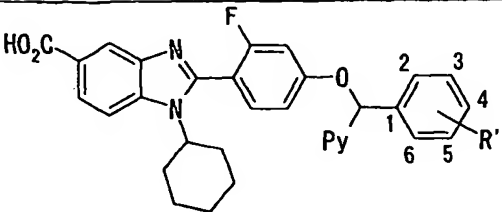
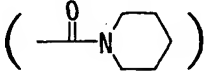
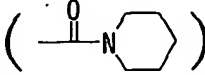
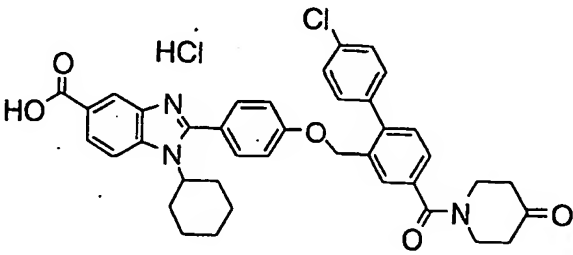
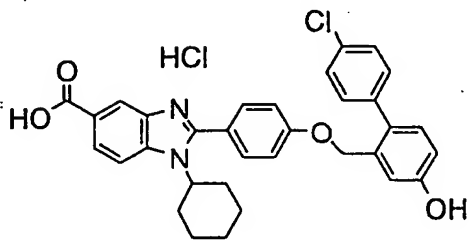
 <p style="text-align: right;">Py: ピリジル基</p>		
実施例 番号	Py	R'
2591	3-Py	-H
2592	3-Py	3-(·F)
2593	3-Py	3-(·Cl)
2594	3-Py	3-(·Me)
2595	3-Py	3-(·CF <sub>3</sub> )
2596	3-Py	3-(·Ac)
2597	3-Py	3-(·CO <sub>2</sub> H)
2598	3-Py	3-(·CO <sub>2</sub> Me)
2599	3-Py	3-(  )
2600	3-Py	3-(·CONH <sub>2</sub> )
2601	3-Py	3-{·CON(Me) <sub>2</sub> }
2602	3-Py	4-(·F)
2603	3-Py	4-(·Cl)
2604	3-Py	4-(·Me)
2605	3-Py	4-(·CF <sub>3</sub> )
2606	3-Py	4-(·Ac)
2607	3-Py	4-(·CO <sub>2</sub> H)
2608	3-Py	4-(·CO <sub>2</sub> Me)
2609	3-Py	4-(  )
2610	3-Py	4-(·CONH <sub>2</sub> )
2611	3-Py	4-{·CON(Me) <sub>2</sub> }

表 219

実施例番号	328	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=9.0 Hz), 8.02 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.80 (1H, s), 7.71 (2H, d, J=8.4 Hz), 7.61 (1H, d, J=9.3 Hz), 7.55-7.45 (3H, m), 7.46 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.7 Hz), 5.16 (2H, s), 4.34 (1H, m), 4.20-3.40 (4H, m), 2.60-2.15 (6H, m), 2.10-1.90 (2H, m), 1.85-1.70 (2H, m), 1.65-1.55 (1H, m), 1.50-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	662 (M+1)	

実施例番号	329	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 9.80 (1H, brs), 8.32 (1H, s), 8.30 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.06 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.74 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.48-7.37 (4H, m), 7.22 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.17 (1H, d, J=8.2 Hz), 7.05 (1H, d, J=2.3 Hz), 6.88 (1H, dd, J=8.3, 2.5 Hz), 5.04 (2H, s), 4.37 (1H, m), 2.37-2.22 (2H, m), 2.11-1.98 (2H, m), 1.93-1.81 (2H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.56-1.22 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	553 (M+1)	

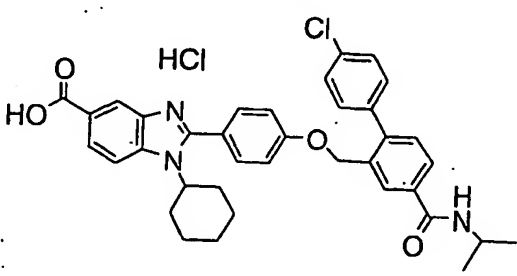
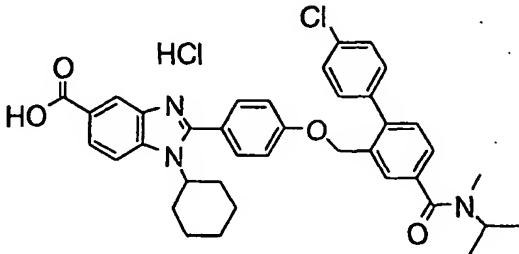
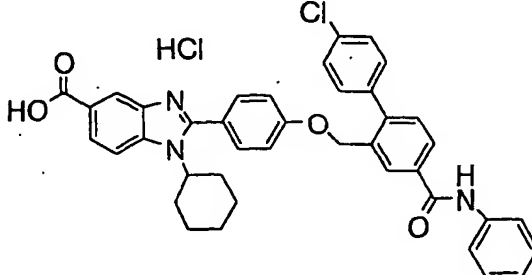
実施例番号	330	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.38 (1H, d, J=7.5 Hz), 8.32 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=9.0 Hz), 8.16 (1H, s), 8.05 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.96 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.75 (2H, d, J=8.4 Hz), 7.53-7.43 (5H, m), 7.25 (2H, d, J=8.4 Hz), 5.13 (2H, s), 4.36 (1H, m), 4.12 (1H, sept, J=6.9 Hz), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.95 (2H, m), 1.90-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m), 1.18 (6H, d, J=6.6 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	622 (M+1)	

表 220

実施例番号	331	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.75-7.41 (9H, m), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 4.36 (1H, m), 4.00-3.90 (1H, m), 2.84 (3H, brs), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-2.00 (2H, m), 1.95-1.75 (2H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.00 (7H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	636 (M+1)	

実施例番号	332	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.12 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.27 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=7.9Hz), 8.03 (1H, d, J=8.6Hz), 7.82 (2H, d, J=7.5Hz), 7.73 (2H, d, J=8.7Hz), 7.56-7.52 (5H, m), 7.38 (2H, t, J=7.9Hz), 7.26 (2H, d, J=8.7Hz), 7.13 (1H, t, J=7.5Hz), 5.20 (2H, s), 4.35 (1H, br t, J=11.7Hz), 2.37-2.19 (2H, m), 2.07-1.96 (2H, m), 1.92-1.79 (2H, m), 1.69-1.58 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	656 (M+1)	

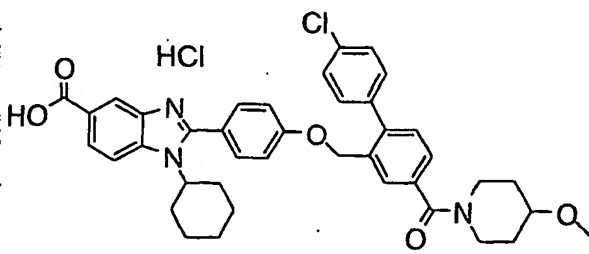
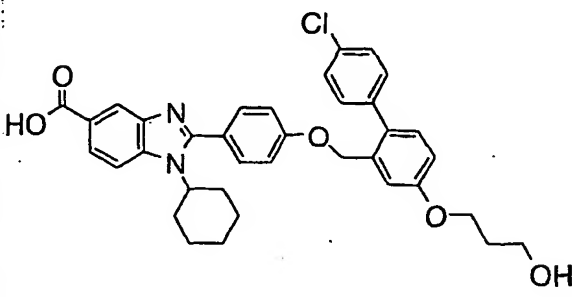
実施例番号	333	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.24 and 8.03 (2H, ABq, J=8.8Hz), 7.71 and 7.22 (4H, A'B'q, J=8.8Hz), 7.69 (1H, s), 7.52 (4H, s), 7.50 and 7.43 (2H, A''B''q, J=7.7Hz), 5.15 (2H, s), 4.35 (1H, br t, J=12.1Hz), 4.05-3.15 (5H, br m), 3.27 (3H, s), 2.39-2.20 (2H, m), 2.07-1.75 (6H, m), 1.70-1.58 (1H, m), 1.55-1.20 (5H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	678 (M+1)	

表 221

実施例番号	334	<sup>1</sup> H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.22 (1H, d, J=1.5Hz), 8.01 (1H, d, J=9.0Hz), 7.89 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.61 (2H, d, J=8.6Hz), 7.50-7.39 (4H, m), 7.27 (1H, d, J=8.6Hz), 7.22 (1H, d, J=2.6Hz), 7.13 (2H, d, J=8.6Hz), 7.04 (1H, dd, J=8.2, 2.6Hz), 5.04 (2H, s), 4.28 (1H, m), 4.11 (2H, t, J=6.3Hz), 3.57 (2H, t, J=6.3Hz), 2.38-2.17 (2H, m), 2.00-1.79 (6H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.52-1.16 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	611 (M+1)	

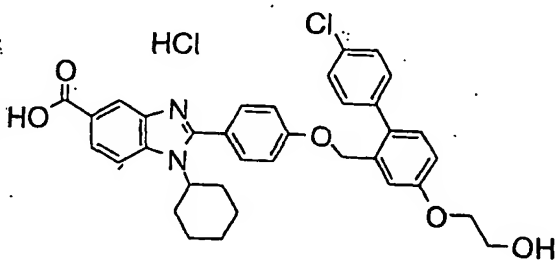
実施例番号	335	<sup>1</sup> H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.04 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.72 (2H, d, J=9.0Hz), 7.60-7.40 (4H, m), 7.32-7.19 (4H, m), 7.06 (1H, dd, J=8.6, 3.0Hz), 5.08 (2H, s), 4.36 (1H, m), 4.06 (2H, t, J=4.8Hz), 3.74 (2H, t, J=4.8Hz), 2.38-2.19 (2H, m), 2.13-1.97 (2H, m), 1.94-1.78 (2H, m), 1.72-1.59 (1H, m), 1.52-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	597 (M+1)	

表 2 2 2

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 I C <sub>50</sub> [ $\mu$ M]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 I C <sub>50</sub> [ $\mu$ M]
340	0.017	360	0.014
341	0.025	361	0.028
342	0.015	362	0.020
343	0.017	363	0.11
344	0.016	364	0.12
345	0.012	365	0.020
346	0.025	366	0.024
347	0.022	367	0.011
348	0.013	368	0.024
349	0.021	369	0.022
350	0.020	370	0.017
351	0.019	371	0.015
352	0.013	372	0.033
353	0.023	373	0.013
354	0.013	374	0.013
355	0.015	375	0.012
356	0.016	376	0.014
357	0.019	377	0.012
358	0.017	378	0.018
359	0.015	379	0.021

表 2 2 3

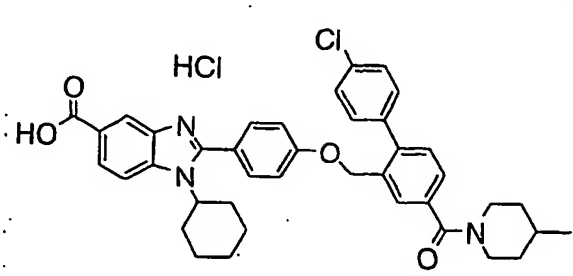
実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
380	0.023	409	0.020
381	0.011	410	0.018
382	0.015	411	0.015
383	0.013	412	0.019
384	0.016	413	0.026
385	0.019	414	0.024
386	0.018	415	0.019
387	0.025	416	0.024
388	0.020	417	0.029
389	0.012	418	0.016
390	0.014	419	0.021
391	0.017	420	0.015
392	0.014	421	0.017
393	0.011	422	0.017
394	0.019	423	0.017
395	0.016	424	0.020
396	0.025	425	0.026
397	0.037	426	0.053
398	0.077	427	0.020
399	0.032	428	0.026



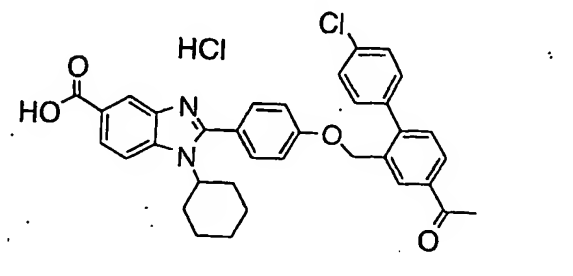
表 2 2 4

実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]	実施例 番号	HCVポリメラーゼ 阻害活性 $IC_{50}$ [ $\mu M$ ]
429	0.017	455	0.015
430	0.017	456	0.017
431	0.015	457	0.015
432	0.022	458	0.015
433	0.014	459	0.014
434	0.011	460	0.017
435	0.012	461	0.021
436	0.026	462	0.028
440	0.070	463	0.026
442	0.024	464	0.030
443	0.030	465	0.033
445	0.33	466	0.023
446	0.016	467	0.032
447	0.12	468	0.028
448	0.20	469	0.024
449	0.025	502	0.024
450	0.040	503	0.196
451	0.031	601	0.32
452	0.028	701	0.052
454	0.013		

表 225

実施例番号	341	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.25 (1H, d, J=8.7Hz), 8.03 (1H, dd, J=8.7Hz), 7.72 and 7.22 (4H, Abq, J=8.8Hz), 7.67 (1H, d, J=1.5Hz), 7.52 (4H, s), 7.49 (1H, dd, J=7.9, 1.5Hz), 7.43 (1H, d, J=7.9Hz), 4.46 (1H, brs), 4.35 (1H, brt, J=12.4Hz), 3.62 (1H, brs), 3.06 (1H, brs), 2.79 (1H, brs), 2.38-2.20 (2H, brm), 2.08-1.81 (4H, brm), 1.77-1.52 (4H, brm), 1.46-1.20 (3H, brm), 1.19-1.00 (2H, brm), 0.94 and 0.92 (total 3H, each s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	662 (M+1)	

実施例番号	342	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.28 (1H, d, J=1.5Hz), 8.26 (1H, d, J=1.8Hz), 8.19 (1H, d, J=8.8Hz), 8.07 (1H, dd, J=7.7, 1.8Hz), 8.00 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7.70 and 7.22 (4H, Abq, J=8.8Hz), 7.56-7.50 (1H, m), 7.56 (4H, s), 5.17 (2H, s), 4.33 (1H, brt, J=12.5Hz), 2.05 (3H, s), 2.37-2.20 (2H, brm), 2.06-1.80 (4H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.50-1.20 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	679 (M+1)	

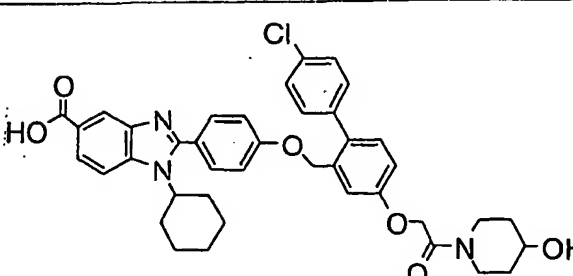
実施例番号	343	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.20 (1H, d, J=1.5Hz), 7.93 (1H, d, J=8.6Hz), 7.84 (1H, dd, J=8.3Hz, 1.5Hz), 7.57 (2H, d, J=8.6Hz), 7.50-7.40 (4H, m), 7.27 (1H, d, J=8.2Hz), 7.22 (1H, d, J=2.6Hz), 7.10 (2H, d, J=8.6Hz), 7.01 (1H, dd, J=8.6Hz, 2.6Hz), 5.02 (2H, s), 4.89 (2H, s), 4.78 (1H, d, J=4.1Hz), 4.38-4.18 (1H, m), 3.96-3.81 (1H, m), 3.78-3.62 (2H, m), 3.27-2.99 (2H, m), 2.35-1.15 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	694 (M+1)	

表 226

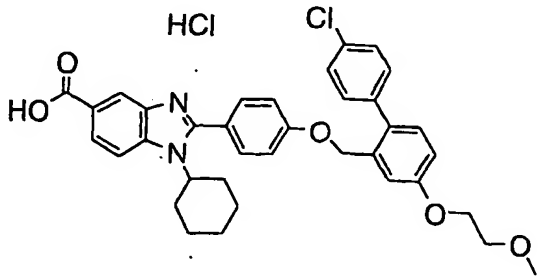
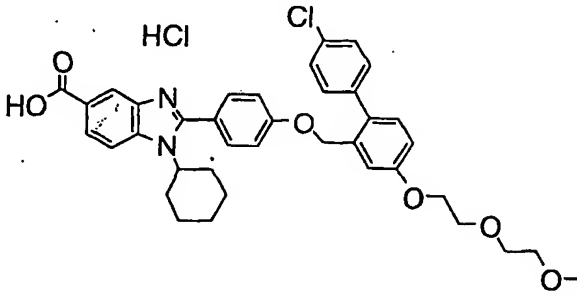
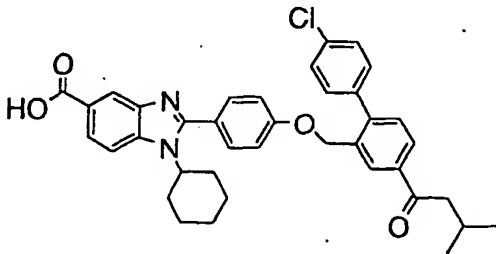
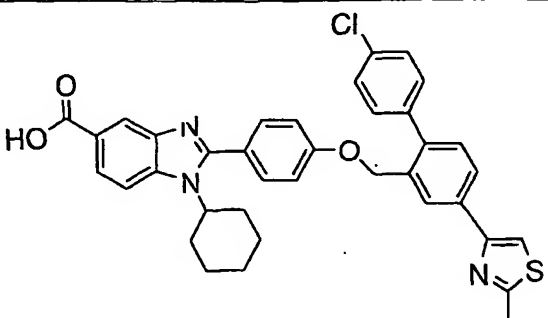
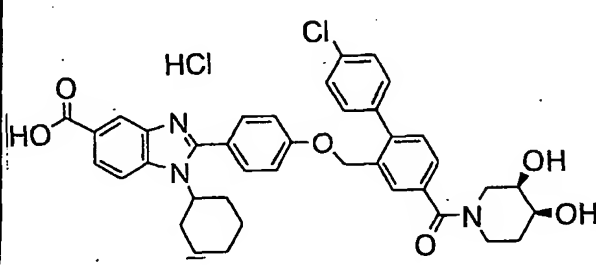
実施例番号	344	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.7Hz), 8.02 (1H, d, J=8.4Hz), 7.71 (2H, d, J=8.7Hz), 7.55-7.15 (8H, m), 7.07 (1H, dd, J=8.4Hz, 3.0Hz), 5.07 (2H, s), 4.35 (1H, m), 4.17 (2H, t, J=4.5Hz), 3.69 (2H, t, J=4.5Hz), 3.32 (3H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.80 (4H, m), 1.75-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	611 (M+1)	
実施例番号	345	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.22 (1H, d, J=8.7Hz), 8.01 (1H, d, J=8.7Hz), 7.70 (1H, d, J=8.7Hz), 7.50-7.15 (8H, m), 7.07 (1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 5.07 (2H, s), 4.35 (1H, m), 4.17 (2H, t, J=4.2Hz), 3.76 (2H, t, J=4.5Hz), 3.65-3.40 (4H, m), 3.25 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 2.10-1.80 (4H, m), 1.75-1.65 (1H, m), 1.65-1.20 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	655 (M+1)	
実施例番号	346	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.26 (1H, d, J=1.9Hz), 8.23 (1H, d, J=1.5Hz), 8.08-8.02 (2H, m), 7.91 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.63 and 7.16 (4H, Abq, J=8.9Hz), 7.56-7.51 (5H, m), 5.15 (2H, s), 4.29 (1H, brt, J=11.7Hz), 2.96 (2H, d, J=6.9Hz), 2.37-2.12 (3H, m), 2.00-1.79 (4H, brm), 1.71-1.60 (1H, brm), 1.49-1.19 (3H, brm), 0.97 and 0.95 (total 6H, each s)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	621 (M+1)	

表 227

実施例番号	347	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.26(1H, s), 8.22(1H, s), 8.06(1H, s), 8.05(1H, d, J=8.0Hz), 7.94 and 7.85(2H, ABq, J=8.8Hz), 7.59 and 7.15(4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.52(4H, s), 7.44(1H, d, J=8.0Hz), 5.12(2H, s), 4.27(1H, brt, J=11.4Hz), 2.38-2.18(2H, brm), 1.97-1.77(4H, brm), 1.70-1.59(1H, brm), 1.49-1.17(3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	634 (M+1)	

実施例番号	348	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32(1H, s), 8.29(1H, d, J=9.0Hz), 8.06(1H, d, J=8.7Hz), 7.74(2H, d, J=9.0Hz), 7.72(1H, brs), 7.60-7.45(5H, m), 7.42(1H, d, J=7.8Hz), 7.24(2H, d, J=8.7Hz), 5.15(2H, s), 4.37(1H, m), 4.00-3.10(6H, m), 2.40-2.18(2H, m), 2.15-1.95(2H, m), 1.90-1.80(2H, m), 1.75-1.20(6H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	680 (M+1)	

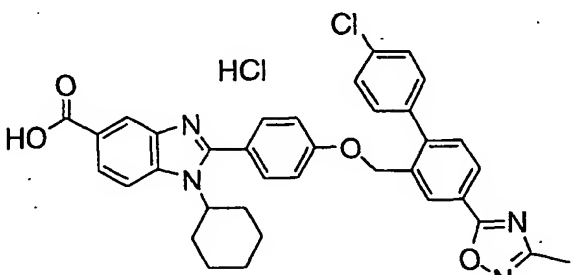
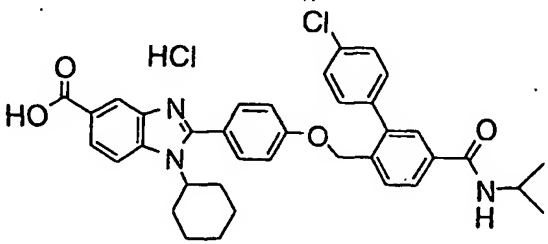
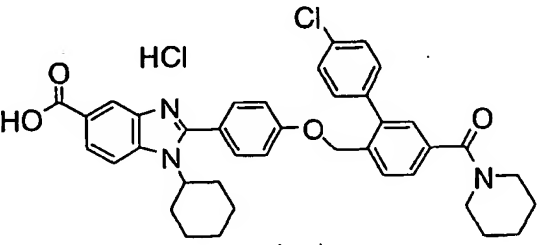
実施例番号	349	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.41(1H, d, J=1.5Hz), 8.33(1H, d, J=1.5Hz), 8.26(1H, d, J=8.7Hz), 8.18(1H, dd, J=2.0Hz, 8.0Hz), 8.04(1H, dd, J=1.5Hz, 9.0Hz), 7.75(2H, d, J=8.7Hz), 7.63(1H, d, J=8.1Hz), 7.62-7.45(4H, m), 7.26(2H, d, J=8.7Hz), 5.25(2H, s), 4.35(1H, m), 2.45(3H, s), 2.40-2.18(2H, m), 2.15-1.95(2H, m), 1.90-1.80(2H, m), 1.75-1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	619 (M+1)	

表 228

実施例番号	350	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.36 (1H, d, J=7.7Hz), 8.29 (1H, s), 8.23 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, d, J=8.6Hz), 7.94 (1H, d, J=7.9Hz), 7.84 (1H, d, J=1.6Hz), 7.80-7.65 (3H, m), 7.53 (4H, s), 5.15 (2H, s), 4.34 (1H, m), 4.12 (1H, m), 2.35-2.20 (2H, m), 2.10-1.60 (5H, m), 1.50-1.20 (3H, m), 1.17 (6H, d, J=6.5Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	622 (M+1)	

実施例番号	351	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.24 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, d, J=8.6Hz), 7.80-7.65 (3H, m), 7.55-7.45 (5H, m), 7.32 (1H, d, J=1.5Hz), 7.22 (2H, d, J=8.8Hz), 5.13 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.60 (2H, m), 3.33 (2H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.15 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	648 (M+1)	

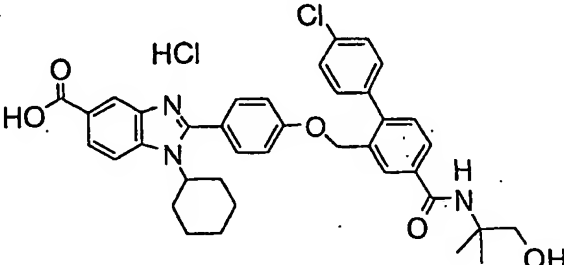
実施例番号	352	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 13.20 (1H, brs), 8.30-8.24 (2H, m), 8.13 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.94 (1H, d, J=8.0Hz), 7.75-7.70 (3H, m), 7.55-7.43 (5H, m), 7.25 (2H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.53 (2H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (9H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	652 (M+1)	

表 229

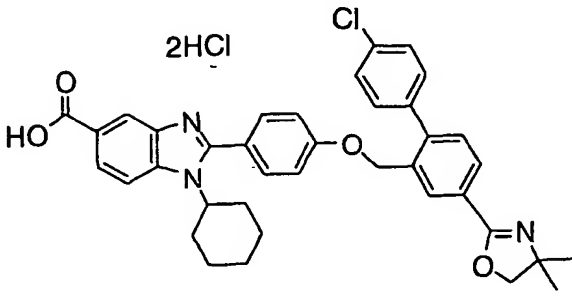
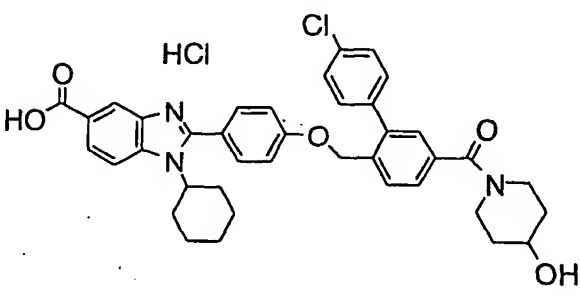
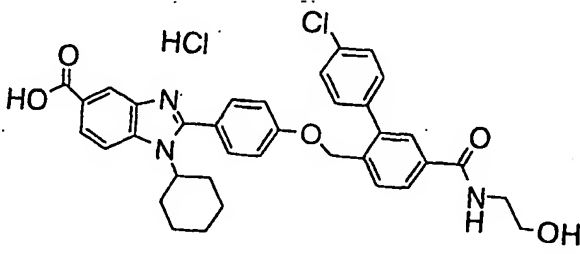
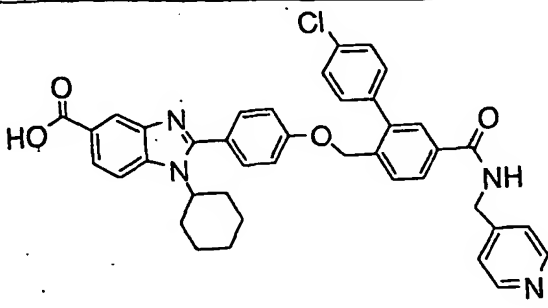
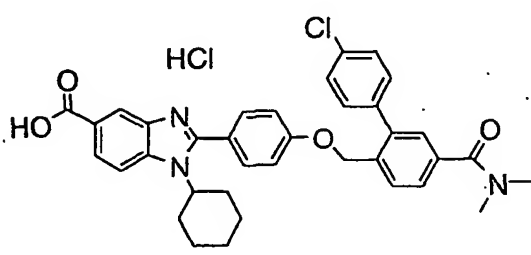
実施例番号	353	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.41 (1H, s), 8.33-8.29 (2H, m), 8.16 (1H, d, J=8.2Hz), 8.07 (1H, d, J=8.6Hz), 7.77 (2H, d, J=8.7H z), 7.62 (1H, d, J=8.0Hz), 7.59- 7.51 (4H, m), 7.28 (2H, d, J=8.8H z), 5.21 (2H, s), 4.56 (2H, s), 4. 37 (1H, m), 2.40-2.18 (2H, m), 2. 15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.2 0 (9H, m)
純度	約 90 % (NMR)	
MS	634 (M+1)	
実施例番号	354	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.31 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=9.0H z), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 7.76- 7.71 (3H, m), 7.51-7.47 (5H, m), 7.33 (1H, s), 7.23 (2H, d, J=9.0H z), 5.14 (2H, s), 4.36 (1H, m), 4. 02 (1H, m), 3.75 (1H, m), 3.56 (1H , m), 3.22 (2H, m), 2.40-2.18 (2H , m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1. 55 (5H, m), 1.50-1.20 (5H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	664 (M+1)	
実施例番号	355	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.62 (1H, t, J=5.7Hz), 8.32-8.3 0 (2H, m), 8.25 (1H, d, J=8.7Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96 (1H, d, J=8.1Hz), 7.86 (1H, s), 7.75 (1H, d, J=9.0Hz), 7.72 (2H, d, J=9 .0Hz), 7.55-7.50 (4H, m), 7.22 (2H, d, J=9.0Hz), 5.17 (2H, s), 4. 35 (1H, m), 3.52 (2H, t, J=6.0Hz) , 3.36 (2H, t, J=6.0Hz), 2.40-2. 18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1. 90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	624 (M+1)	

表 230

実施例番号	356	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 9.30 (1H, t, J=5.9Hz), 8.54 (2H, d, J=5.9Hz), 8.22 (1H, s), 8.02-7.79 (5H, m), 7.59 and 7.12 (4H, ABq, J=8.6Hz), 7.55 (4H, s), 7.37 (2H, d, J=5.9Hz), 5.15 (2H, s), 4.54 (2H, d, J=5.7Hz), 4.26 (1H, brt, J=12.8Hz), 2.36-2.18 (2H, brm), 1.97-1.78 (4H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.47-1.17 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	671 (M+1)	

実施例番号	357	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.5Hz), 8.43 (1H, d, J=8.4Hz), 8.03 (1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.74 (1H, d, J=8.1Hz), 7.73 and 7.23 (4H, ABq, J=9.0Hz), 7.54-7.51 (5H, m), 7.37 (1H, d, J=1.8Hz), 5.14 (2H, s), 4.36 (1H, brt, J=12.1Hz), 2.98 (6H, brs), 2.37-2.20 (2H, brm), 2.08-1.81 (4H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.50-1.21 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	608 (M+1)	

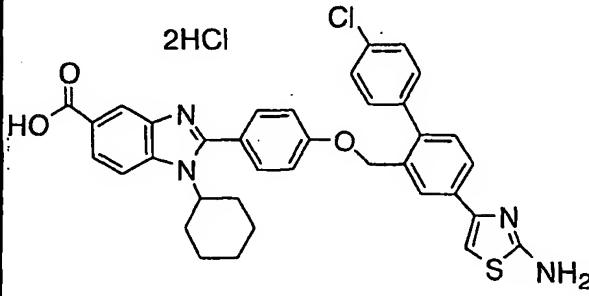
実施例番号	358	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.31 (1H, d, J=8.7Hz), 8.14 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=8.7Hz), 7.92 (1H, d, J=8.0Hz), 7.76 (2H, d, J=8.7Hz), 7.52-7.40 (5H, m), 7.31-7.26 (3H, m), 5.15 (2H, s), 4.37 (1H, m), 2.40-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	約 90% (NMR)	
MS	635 (M+1)	

表 231

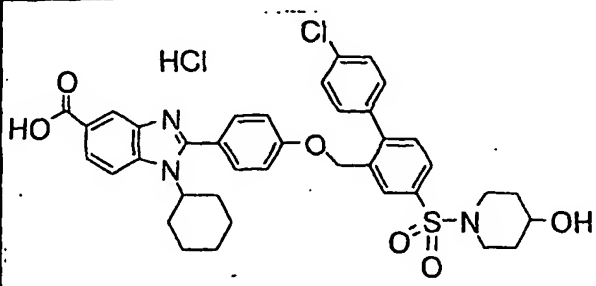
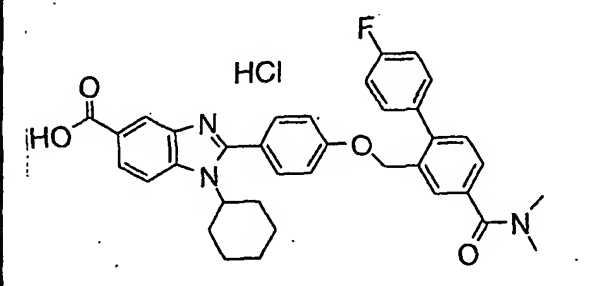
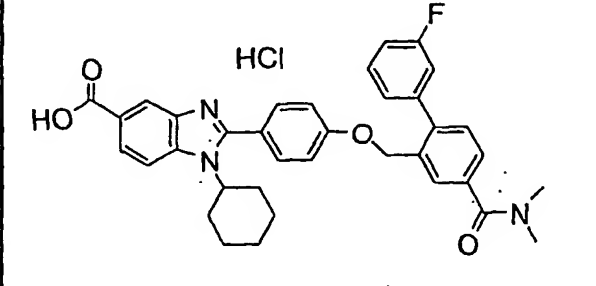
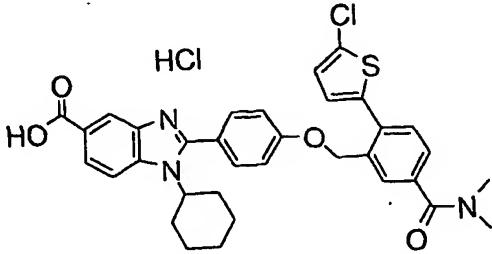
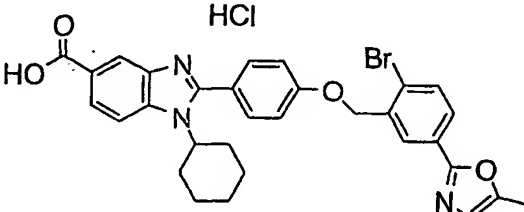
実施例番号	359	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.31 (1H, s), 8.25 (1H, d, J=8.7Hz), 8.10-7.90 (2H, m), 7.82 (1H, dd, J=7.8Hz, 1.8Hz), 7.72 (2H, d, J=9.0Hz), 7.63 (1H, d, J=8.1Hz), 7.23 (2H, d, J=9.0Hz), 5.25 (2H, s), 4.34 (1H, m), 3.65-3.50 (1H, m), 3.20-3.05 (2H, m), 2.90-2.75 (2H, m), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.10 (12H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	700 (M+1)	
実施例番号	360	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.33 (1H, s), 8.30 (1H, d, J=8.5Hz), 8.06 (1H, d, J=10.1Hz), 8.80-8.65 (3H, m), 8.60-8.45 (3H, m), 7.42 (1H, d, J=7.8Hz), 7.35-7.15 (4H, m), 5.15 (2H, s), 4.36 (1H, m), 3.01, 2.97 (6H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	592 (M+1)	
実施例番号	361	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.35-8.20 (2H, m), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 8.80-8.65 (3H, m), 7.60-7.40 (3H, m), 7.40-7.30 (5H, m), 5.17 (2H, s), 4.35 (1H, m), 3.01, 2.97 (6H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.10-1.80 (4H, m), 1.70-1.20 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	592 (M+1)	



表 232

実施例番号	362	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.29 (1H, d, J=8.7Hz), 8.06 (1H, d, J=8.7Hz), 7.79 (2H, d, J=9.0Hz), 7.76 (1H, d, J=9.0Hz), 7.60 (1H, d, J=8.1Hz), 7.53 (1H, dd, J=1.7Hz, 8.0Hz), 7.35 (2H, d, J=8.7Hz), 6.85-6.80 (2H, m), 5.29 (2H, s), 4.38 (1H, m), 3.01, 2.96 (6H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	614 (M+1)	

実施例番号	363	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, d, J=1.3Hz), 8.20-8.10 (2H, m), 8.98 (1H, d, J=8.6Hz), 7.90-7.80 (2H, m), 7.75 (2H, d, J=8.7Hz), 7.36 (2H, d, J=8.7Hz), 7.04 (1H, d, J=1.3Hz), 5.35 (2H, s), 4.36 (1H, m), 2.39 (3H, s), 2.35-2.15 (2H, m), 2.05-1.75 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	586 (M+1)	

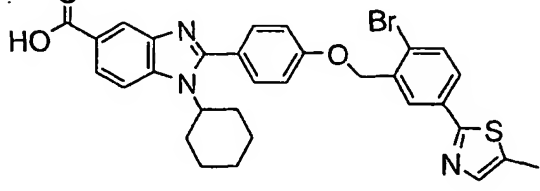
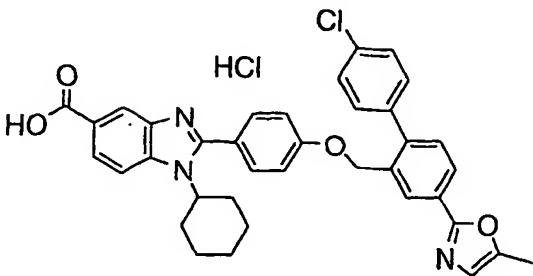
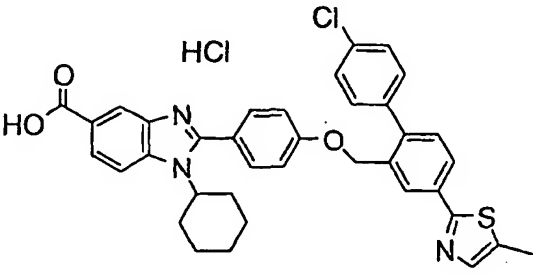
実施例番号	364	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 8.13 (1H, s), 8.04 (1H, d, J=9.0Hz), 7.90-7.70 (4H, m), 7.65 (1H, s), 7.39 (2H, d, J=9.0Hz), 5.37 (2H, s), 4.38 (1H, m), 2.40-2.20 (2H, m), 2.15-2.00 (2H, m), 1.95-1.80 (2H, m), 1.75-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	604 (M+1)	

表 233

実施例番号	365	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.7Hz), 8.00 (2H, t, J=6.9Hz), 7.69 (2H, d, J=8.4Hz), 7.60-7.45 (5H, m), 7.21 (2H, d, J=8.4Hz), 7.05 (1H, s), 5.19 (2H, s), 4.33 (1H, m), 2.41 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 2.10-1.80 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	618 (M+1)	

実施例番号	366	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.26 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.7Hz), 7.95 (2H, d, J=9.6Hz), 7.70-7.40 (8H, m), 7.19 (2H, d, J=8.4Hz), 5.18 (2H, s), 4.30 (1H, m), 2.51 (3H, s), 2.40-2.15 (2H, m), 2.05-1.80 (4H, m), 1.75-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	634 (M+1)	

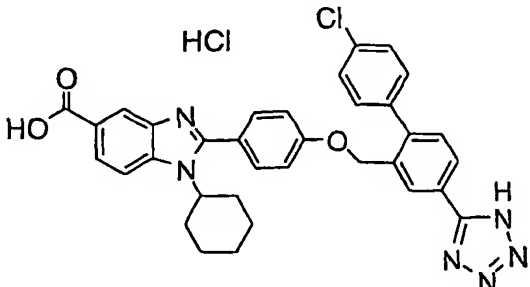
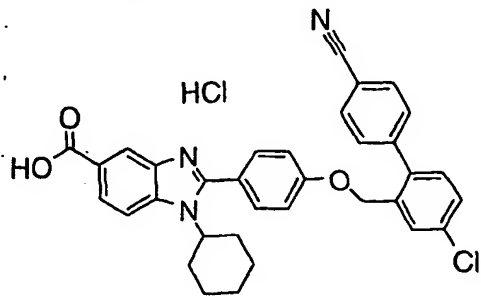
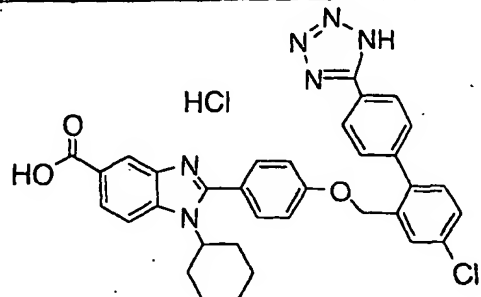
実施例番号	367	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.42 (1H, d, J=1.9Hz), 8.30 (1H, J=1.5Hz), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.18 (1H, dd, J=7.9, 1.9Hz), 8.04 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.75 and 7.29 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.63 (1H, d, J=7.9Hz), 5.23 (2H, s), 4.36 (1H, brt, J=12.3Hz), 2.37-2.20 (2H, brm), 2.08-1.80 (4H, brm), 1.71-1.60 (1H, brm), 1.51-1.21 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	605 (M+1)	

表 234

実施例番号	368	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.25 (1H, d, J=8.6Hz), 8.04 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.93 and 7.67 (4H, ABq, J=8.1Hz), 7.80 (1H, d, J=2.2Hz), 7.72 and 7.21 (4H, A'B'q, J=8.6Hz), 7.60 (1H, dd, J=8.1, 2.2Hz), 7.44 (1H, d, J=8.1Hz), 5.13 (2H, s), 4.34 (1H, brt, J=11.7Hz), 2.37-2.19 (2H, brm), 2.09-1.80 (4H, brm), 1.72-1.60 (1H, brm), 1.50-1.21 (3H, brm)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	562 (M+1)	

実施例番号	369	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.25 (1H, d, J=8.6Hz), 8.16 and 7.72 (4H, ABq, J=8.4Hz), 8.13 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.80 (1H, d, J=2.2Hz), 7.70 and 7.24 (4H, A'B'q, J=8.8Hz), 7.61 (1H, dd, J=8.1, 2.2Hz), 7.48 (1H, d, J=8.1Hz), 5.17 (2H, s), 4.33 (1H, brt, J=12.1Hz), 2.36-2.18 (2H, brm), 2.08-1.77 (4H, brm), 1.69-1.57 (1H, brm), 1.49-1.17 (3H, brm)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	605 (M+1)	

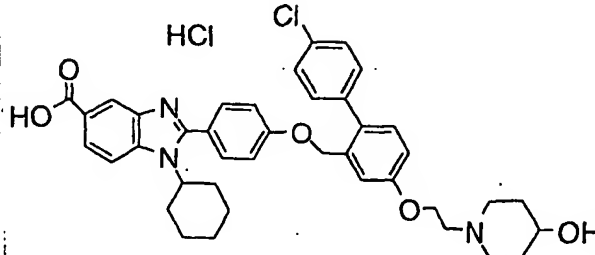
実施例番号	370	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 10.94 (1H, brs), 8.33 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=8.7Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.74 (2H, d, J=8.4Hz), 7.56-7.29 (6H, m), 7.23 (2H, d, J=8.7Hz), 7.13 (1H, d, J=8.7Hz), 5.08 (2H, s), 4.51 (2H, brs), 4.36 (1H, m), 3.94 (1H, brs), 3.75-3.00 (6H, m), 3.20-1.20 (14H, m)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	680 (M+1)	

表 235

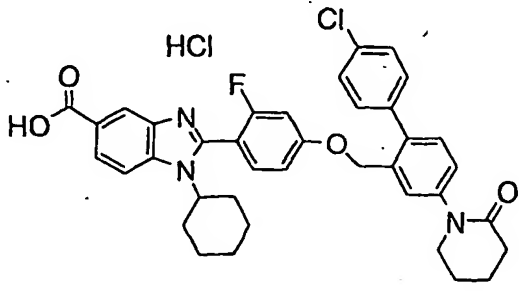
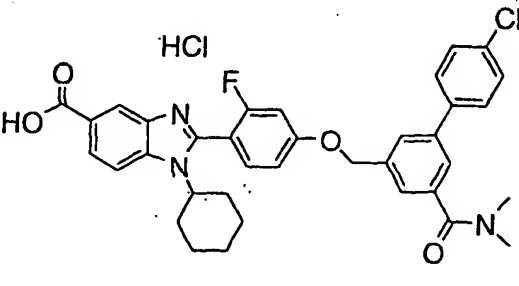
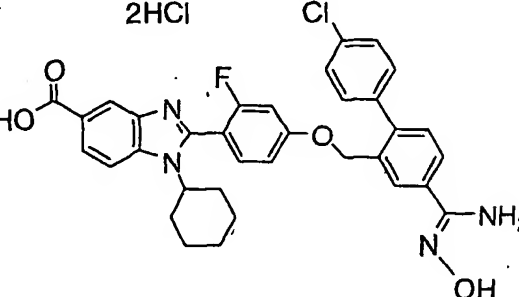
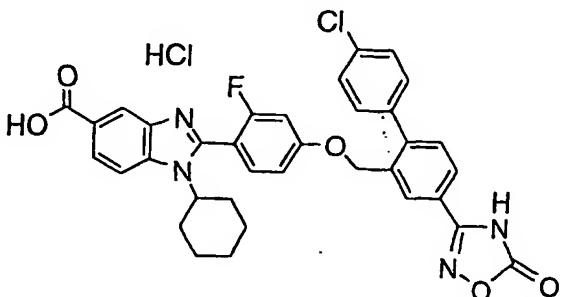
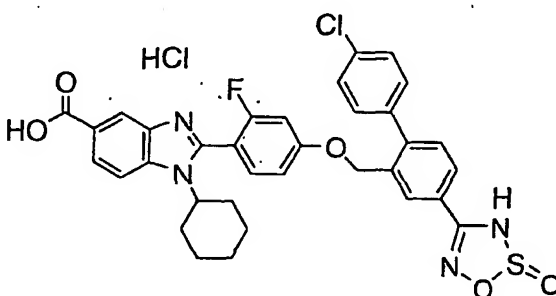
実施例番号	371	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.5Hz), 8.17 (1H, d, J=9.0Hz), 7.99 (1H, dd, J=8.7 Hz, 1.4Hz), 7.70-7.55 (2H, m), 7.50-7.30 (6H, m), 7.19 (1H, dd, J=12.0Hz, 2.2Hz), 7.06 (1H, dd, J=8.6Hz, 2.2Hz), 5.08 (2H, 4.10 (1H, m), 3.68 (2H, brt, J=5.2), 2.50 (2H, brt, J=1.8Hz), 2.30-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (8H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	652 (M+1)	
実施例番号	372	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.11 (1H, d, J=8.6Hz), 7.96 (1H, dd, J=8.6, 1.5Hz), 7.89 (1H, s), 7.78 and 7.56 (4H, ABq, J=8.4Hz), 7.69 (1H, s), 7.66 (1H, t, J=8.8Hz), 7.31 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.18 (1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.37 (2H, s), 4.08 (1H, brt, J=11.0Hz), 3.02 (3H, s), 2.96 (3H, s), 2.31-2.14 (2H, brm), 1.95-1.77 (4H, brm), 1.69-1.59 (31H, brm), 1.46-1.18 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	
実施例番号	373	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 11.40 (1H, brs), 9.25 (2H, brs), 8.29 (1H, d, J=1.3Hz), 8.12-8.09 (2H, m), 7.96 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, dd, J=1.8Hz, 8.1Hz), 7.67-7.63 (2H, m), 7.56 (2H, d, J=8.7Hz), 7.51 (2H, d, J=8.7Hz), 7.17 (1H, d, J=12.0Hz), 7.05 (1H, d, J=8.6Hz), 5.16 (2H, s), 4.05 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	613 (M+1)	

表 236

実施例番号	374	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 13.21 (1H, brs), 8.31 (1H, d, J=1.4Hz), 8.18-8.15 (2H, m), 7.99 (1H, d, J=8.7Hz), 7.94 (1H, dd, J=1.8Hz, 8.0Hz), 7.70-7.53 (6H, m), 7.17 (1H, d, J=12.0Hz), 7.05 (1H, d, J=8.6Hz), 5.20 (2H, s), 4.09 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	639 (M+1)	

実施例番号	375	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.32 (1H, d, J=1.5Hz), 8.23 (1H, d, J=1.5Hz), 8.19 (1H, d, J=9.0Hz), 8.03-7.98 (2H, m), 7.68 (1H, t, J=8.4Hz), 7.60 (1H, d, J=8.1Hz), 7.56 (2H, d, J=9.3Hz), 7.53 (2H, d, J=9.0Hz), 7.22 (1H, dd, J=2.1Hz, 12.0Hz), 7.09 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.4Hz), 5.21 (2H, s), 4.12 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	658 (M+1)	

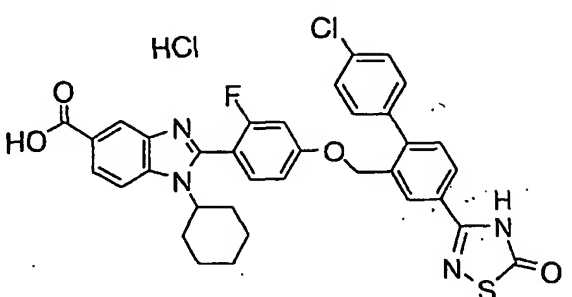
実施例番号	376	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 13.61 (1H, brs), 8.34-8.30 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=8.7Hz), 8.07 (1H, dd, J=1.8Hz, 8.1Hz), 8.02 (1H, dd, J=1.5Hz, 8.7Hz), 7.69 (1H, t, J=8.4Hz), 7.57-7.49 (5H, m), 7.22 (1H, dd, J=2.7Hz, 12.0Hz), 7.09 (1H, dd, J=2.4Hz, 9.0Hz), 5.19 (2H, s), 4.12 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	655 (M+1)	

表 237

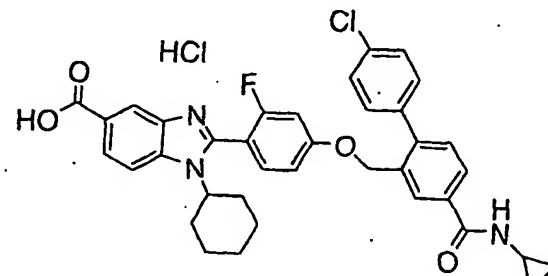
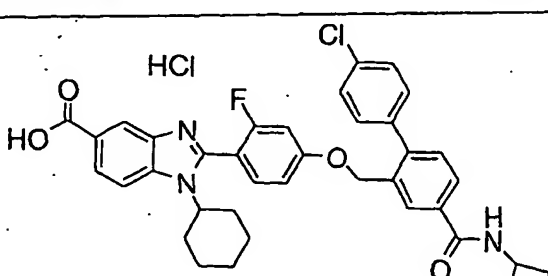
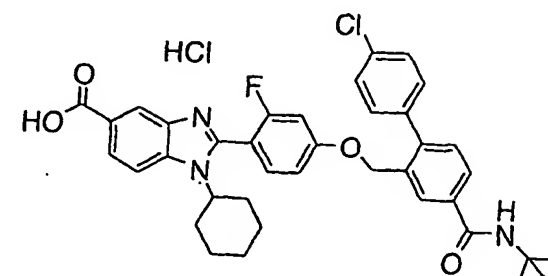
実施例番号	377	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.60 (1H, d, J=4.5Hz), 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.14 (1H, d, J=8.9Hz), 8.13 (1H, d, J=1.5Hz), 7.98 (1H, dd, J=8.9, 1.5Hz), 7.94 (1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.64 (1H, t, J=8.7Hz), 7.52 and 7.49 (4H, ABq, J=9.0Hz), 7.46 (1H, d, J=8.1Hz), 7.18 (1H, dd, J=12.1, 2.3Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.7, 2.3Hz), 5.13 (2H, s), 4.08 (1H, brt, J=12.1Hz), 2.95-2.84 (1H, m), 2.31-2.14 (2H, brm), 1.97-1.78 (4H, brm), 1.72-1.59 (1H, brm), 1.47-1.21 (3H, brm), 0.76-0.58 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	638 (M+1)	
実施例番号	378	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.77 (1H, d, J=1.4Hz), 8.30 (1H, d, J=1.4Hz), 8.16 (1H, d, J=1.8Hz), 8.13 (1H, d, J=8.4Hz), 7.98 (2H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 7.65 (1H, t, J=8.4Hz), 7.53 and 7.49 (4H, ABq, J=8.8Hz), 7.47 (1H, d, J=7.7Hz), 7.18 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.4, 2.2Hz), 5.13 (2H, s), 4.53-4.40 (1H, m), 4.09 (1H, brt, J=12.8Hz), 2.31-2.02 (6H, brm), 1.96-1.80 (4H, brm), 1.78-1.60 (3H, brm), 1.47-1.21 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	652 (M+1)	
実施例番号	379	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, d, J=1.1Hz), 8.11 (1H, d, J=1.5Hz), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz), 7.98-7.91 (2H, m), 7.89 (1H, s), 7.63 (1H, t, J=8.8Hz), 7.52 and 7.48 (4H, ABq, J=8.6Hz), 7.44 (1H, d, J=8.1Hz), 7.17 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.04 (1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.12 (2H, s), 4.07 (1H, brt, J=12.4Hz), 2.33-2.14 (2H, brm), 1.96-1.79 (4H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.48-1.21 (3H, brm), 1.41 (9H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	

表 238

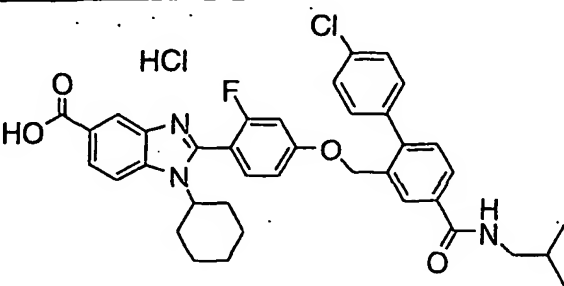
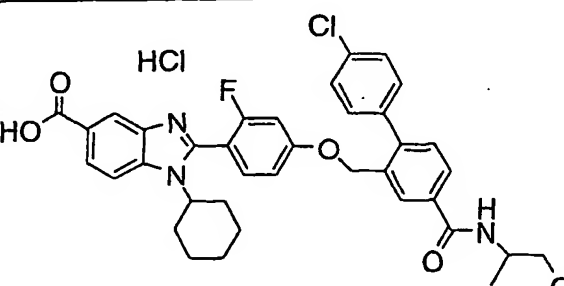
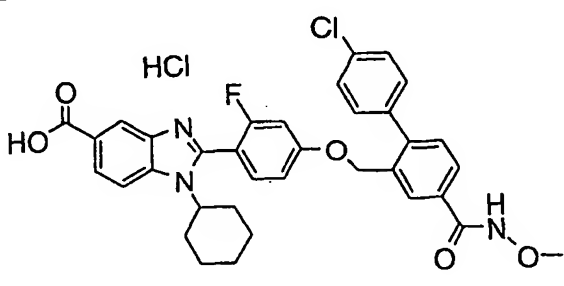
実施例番号	380	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.62 (1H, t, J=5.5Hz), 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.17 (1H, d, J=1.8Hz), 8.14 (1H, d, J=8.8Hz), 7.98 (1H, dd, J=8.1, 1.8Hz), 7.64 (1H, t, J=8.8Hz), 7.52 and 7.50 (4H, ABq, J=8.8Hz), 7.48 (1H, d, J=8.1Hz), 7.18 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.08 (1H, brt, J=12.1Hz), 3.13 (1H, t, J=6.2Hz), 2.31-2.14 (2H, brm), 1.97-1.78 (5H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.47-1.21 (3H, brm), 0.92 (3H, s), 0.90 (3H, s)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	654 (M+1)	
実施例番号	381	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.27 (1H, d, J=8.3Hz), 8.18 (1H, d, J=1.9Hz), 8.13 (1H, d, J=8.7Hz), 8.01-7.96 (2H, m), 7.64 (1H, t, J=8.7Hz), 7.52 and 7.49 (1H, ABq, J=8.8Hz), 7.49 (1H, d, J=7.9Hz), 7.18 (1H, dd, J=12.1, 2.3Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.7, 2.3Hz), 5.13 (2H, s), 4.12-4.00 (2H, m), 3.52-3.34 (2H, m), 2.31-2.14 (2H, brm), 1.97-1.79 (4H, brm), 1.71-1.60 (1H, brm), 1.48-1.21 (3H, m), 1.17 and 1.15 (total 3H, each s)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	656 (M+1)	
実施例番号	382	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.13 (1H, d, J=8.8Hz), 8.09 (1H, d, J=1.5Hz), 7.98 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7.86 (1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.64 (1H, J=8.8Hz), 7.55-7.47 (5H, m), 7.17 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.08 (1H, brt, J=12.8Hz), 3.75 (3H, s), 2.32-2.14 (2H, brm), 1.96-1.78 (4H, brm), 1.70-1.59 (1H, brm), 1.47-1.21 (3H, brm)
純度	> 90 % (NMR)	
MS	628 (M+1)	

表 239

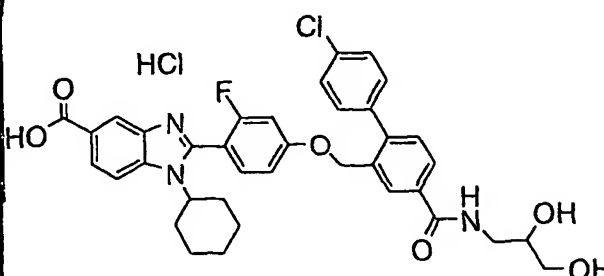
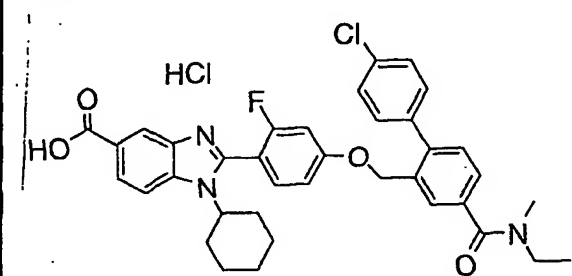
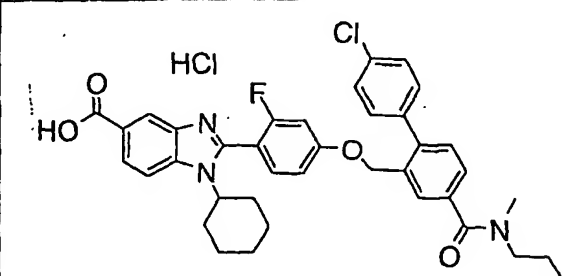
実施例番号	383	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.57 (1H, t, J=5.5Hz), 8.29 (1H, d, J=1.4Hz), 8.19 (1H, d, J=1.5Hz), 8.12 (1H, d, J=9.2Hz), 8.01-7.95 (2H, m), 7.64 (1H, t, J=8.8Hz), 7.53 and 7.50 (4H, ABq, J=8.8Hz), 7.48 (1H, d, J=7.7Hz), 7.17 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.04 (1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.14 (2H, s), 4.08 (1H, brt, J=13.9Hz), 3.70-3.66 (1H, m), 3.48-3.36 (3H, m), 3.28-3.20 (1H, m), 2.32-2.13 (2H, brm), 1.96-1.79 (4H, brm), 1.71-1.60 (1H, brm), 1.47-1.19 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	672 (M+1)	
実施例番号	384	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30 (1H, d, J=1.5Hz), 8.14 (1H, d, J=8.4Hz), 7.98 (1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.68 (1H, brs), 7.63 (1H, t, J=8.4Hz), 7.51 (5H, s), 7.43 (1H, d, J=8.1Hz), 7.17 (1H, dd, J=12.5, 1.8Hz), 7.03 (1H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 4.08 (1H, brt, J=11.4Hz), 3.50 and 3.30 (total 2H, each brs), 2.97 (3H, brs), 2.33-2.13 (2H, brm), 1.96-1.79 (4H, brm), 1.70-1.59 (1H, brm), 1.47-1.03 (6H, brm),
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	
実施例番号	385	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.12 (1H, d, J=8.8Hz), 7.97 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7.72-7.60 (2H, m), 7.55-7.42 (6H, m), 7.16 (1H, d, J=11.7Hz), 7.03 (1H, d, J=8.4Hz), 5.15 (2H, s), 4.07 (1H, brt, J=12.5Hz), 3.44 and 3.22 (total 2H, each brs), 2.97 (3H, brs), 2.32-2.13 (2H, brm), 1.72-1.50 (3H, brm), 1.47-1.23 (3H, brm), 0.93 and 0.72 (total 3H, each brs)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	



表 240

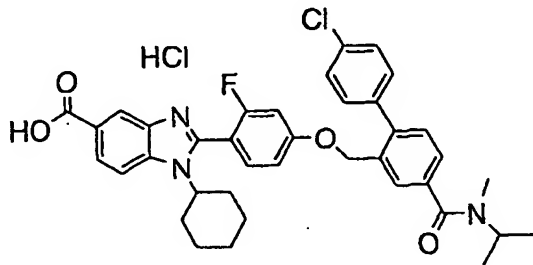
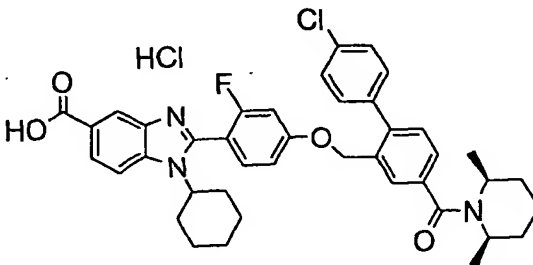
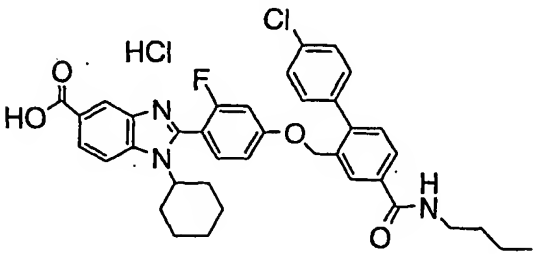
実施例番号	386	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.12 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.74-7.60 (2H, m), 7.54-7.42 (6H, m), 7.17 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.02 (1H, dd, J=8.3, 2.2Hz), 5.15 (2H, s), 4.06 (1H, brt, J=12.8Hz), 3.92 (1H, brs), 2.85 (3H, brs), 2.32-2.14 (2H, brm), 1.96-1.79 (4H, brm), 1.70-1.59 (1H, brm), 1.46-1.07 (3H, brm), 1.15 (6H, brs)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	
実施例番号	387	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.14 and 7.97 (2H, ABq, J=8.7Hz), 7.63 (1H, s), 7.63 (1H, t, J=8.7Hz), 7.51-7.41 (6H, m), 7.16 (1H, dd, J=12.1, 1.9Hz), 7.02 (1H, dd, J=8.7, 1.9Hz), 5.16 (2H, s), 4.26 (2H, brs), 4.07 (1H, brt, J=12.1Hz), 2.32-2.14 (2H, brm), 1.97-1.78 (5H, brm), 1.70-1.15 (9H, brm), 1.24 (3H, s), 1.21 (3H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	694 (M+1)	
実施例番号	388	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.58 (1H, m), 8.29 (1H, s), 8.20-8.10 (2H, m), 8.05-7.90 (2H, m), 7.64 (1H, t, J=8.4Hz), 7.60-7.40 (5H, m), 7.15 (1H, d, J=12.3Hz), 7.04 (1H, d, J=8.4Hz), 5.13 (2H, s), 4.08 (1H, m), 3.40-3.20 (2H, m), 2.35-2.10 (2H, m), 2.00-1.20 (12H, m), 0.91 (3H, t, J=6.9Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	

表 241

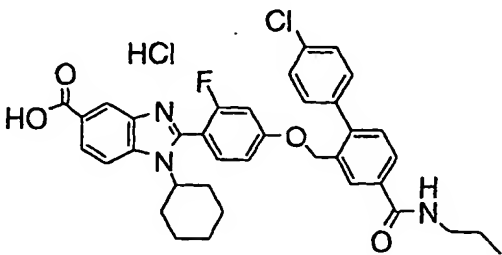
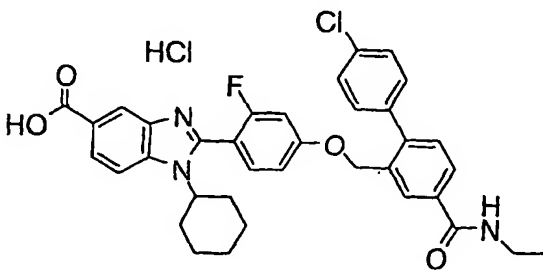
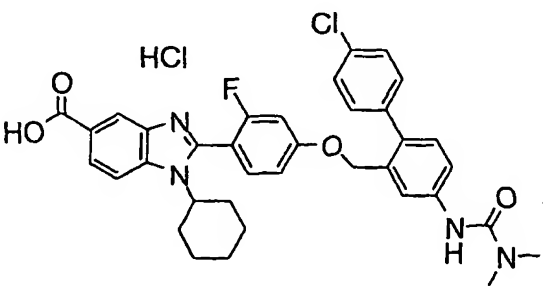
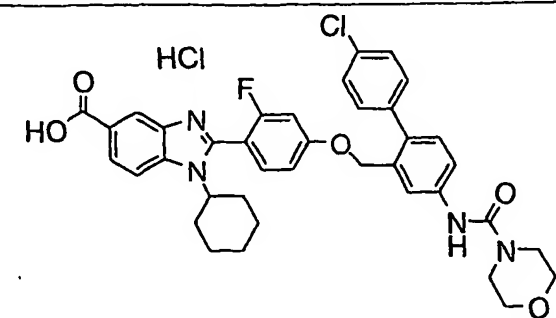
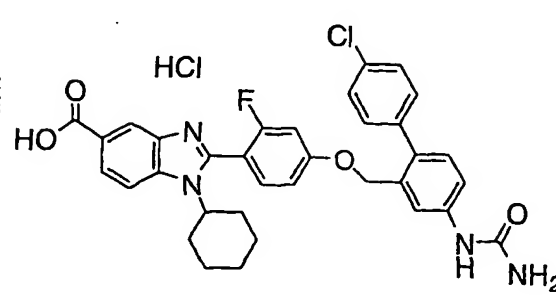
実施例番号	389	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.60 (1H, m), 8.29 (1H, s), 8.20-7.90 (4H, m), 7.64 (1H, t, J=9.0 Hz), 7.60-7.40 (5H, m), 7.17 (1H, d, J=12.0 Hz), 7.04 (1H, d, J=8.7 Hz), 5.13 (2H, s), 4.80 (1H, m), 3.35-3.15 (2H, m), 2.30-2.05 (2H, m), 2.00-1.10 (10H, m), 0.91 (3H, t, J=7.5 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	
実施例番号	390	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.62 (1H, m), 8.30 (1H, s), 8.20-8.10 (2H, m), 8.05-7.90 (2H, m), 7.65 (1H, t, J=8.4 Hz), 7.60-7.40 (5H, m), 7.18 (1H, d, J=12.0 Hz), 7.05 (1H, d, J=8.4 Hz), 5.14 (2H, s), 4.09 (1H, m), 3.40-3.20 (2H, m), 2.35-2.10 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.75-1.60 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m), 1.15 (3H, t, J=7.2 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	
実施例番号	391	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.54 (1H, s), 8.31 (1H, s), 8.19 (1H, d, J=8.6 Hz), 8.01 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.81 (1H, d, J=2.1 Hz), 7.64 (1H, t, J=8.4 Hz), 7.61 (1H, dd, J=2.3 Hz, 8.4 Hz), 7.47 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.43 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.25 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.17 (1H, dd, J=2.3 Hz, 12.1 Hz), 7.05 (1H, dd, J=2.3 Hz, 8.6 Hz), 5.05 (2H, s), 4.12 (1H, m), 2.96 (6H, s), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	641 (M+1)	

表 242

実施例番号	392	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.79(1H, s), 8.29(1H, d, J=1.5Hz), 8.13(1H, d, J=8.8Hz), 7.98(1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7.80(1H, d, J=2.2Hz), 7.63(1H, t, J=8.4Hz), 7.61(1H, dd, J=8.2, 2.2Hz), 7.47 and 7.43(4H, ABq, J=8.8Hz), 7.26(1H, d, J=8.2Hz), 7.14(1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.02(1H, d, J=8.4, 2.2Hz), 5.05(2H, s), 4.08(1H, brt, J=12.1Hz), 3.64-3.61(2H, m), 3.48-3.45(2H, m), 2.32-2.13(2H, brm), 1.96-1.78(4H, brm), 1.70-1.66(1H, brm), 1.44-1.19(3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	683 (M+1)	

実施例番号	393	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.94(1H, s), 8.31(1H, d, J=1.0Hz), 8.18(1H, d, J=8.6Hz), 8.00(1H, dd, J=1.4Hz, 8.8Hz), 7.71(1H, d, J=2.2Hz), 7.66(1H, t, J=8.6Hz), 7.52(1H, dd, J=2.4Hz, 8.6Hz), 7.46(2H, d, J=8.6Hz), 7.42(2H, d, J=8.2Hz), 7.24(1H, d, J=8.4Hz), 7.16(1H, d, J=12.1Hz), 7.04(1H, dd, J=2.4Hz, 8.8Hz), 5.05(2H, s), 4.13(1H, m), 2.40-2.10(2H, m), 2.00-1.75(4H, m), 1.70-1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	613 (M+1)	

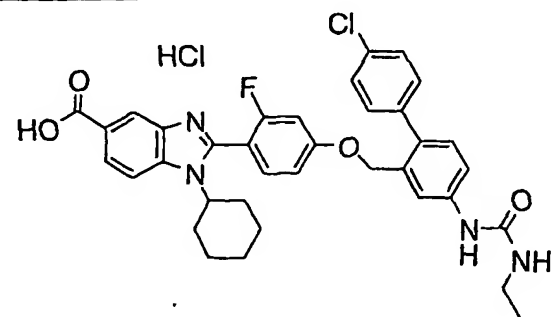
実施例番号	394	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.93(1H, s), 8.31(1H, d, J=1.4Hz), 8.19(1H, d, J=8.8Hz), 8.01(1H, d, J=8.7Hz), 7.71(1H, d, J=2.2Hz), 7.66(1H, t, J=8.5Hz), 7.51(1H, dd, J=2.2Hz, 8.4Hz), 7.46(2H, d, J=8.6Hz), 7.41(2H, d, J=8.7Hz), 7.23(1H, d, J=8.4Hz), 7.16(1H, d, J=12.2Hz), 7.05(1H, d, J=8.7Hz), 5.05(2H, s), 4.13(1H, m), 3.12(2H, q, J=7.2Hz), 2.40-2.10(2H, m), 2.00-1.75(4H, m), 1.70-1.60(1H, m), 1.55-1.20(3H, m), 1.06(3H, t, J=7.2Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	641 (M+1)	

表 243

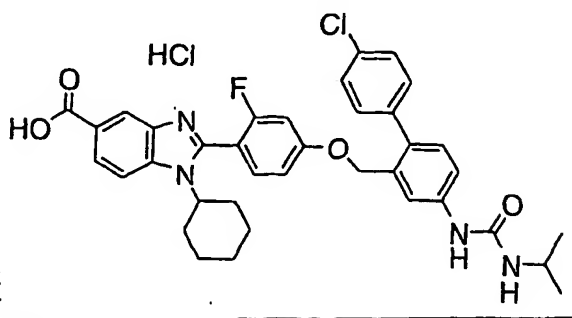
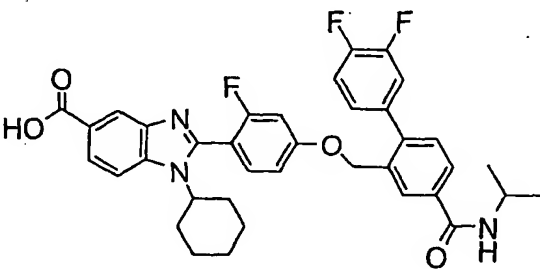
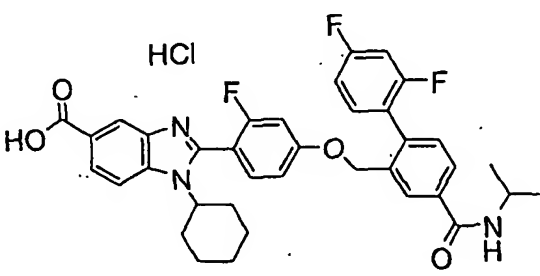
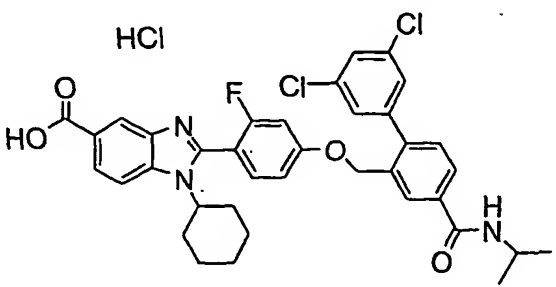
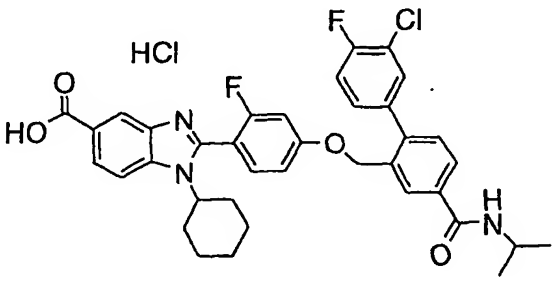
実施例番号	395	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.83 (1H, s), 8.32 (1H, d, J=1.4 Hz), 8.21 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.02 (1H, dd, J=1.4 Hz, 8.7 Hz), 7.71 (1H, d, J=2.1 Hz), 7.68 (1H, t, J=8.6 Hz), 7.49 (1H, dd, J=2.2 Hz, 8.4 Hz), 7.46 (2H, d, J=8.4 Hz), 7.41 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.23 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.17 (1H, d, J=12.2 Hz), 7.06 (1H, d, J=8.7 Hz), 6.30 (1H, brs), 5.05 (2H, s), 4.14 (1H, m), 3.77 (1H, sept, J=6.5 Hz), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m), 1.11 (6H, d, J=6.5 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	655 (M+1)	
実施例番号	396	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.37 (1H, d, J=7.3 Hz), 8.25 (1H, s), 8.15 (1H, s), 7.97 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.88 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.58-7.47 (4H, m), 7.31 (1H, m), 7.11 (1H, dd, J=8.4, 2.2 Hz), 6.98 (1H, dd, J=8.4, 2.2 Hz), 5.13 (2H, s), 4.13 (1H, q, J=6.6 Hz), 3.98 (1H, m), 2.19 (2H, m), 1.86 (4H, m), 1.62 (1H, m), 1.31 (3H, m), 1.20 (6H, d, J=6.6 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	642 (M+1)	
実施例番号	397	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.40 (1H, d, J=7.9 Hz), 8.28 (1H, d, J=1.9 Hz), 8.15 (1H, d, J=1.9 Hz), 8.11 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.96 (2H, m), 7.56 (1H, t, J=8.7 Hz), 7.45 (3H, m), 7.18 (1H, m), 7.08 (1H, dd, J=12.1, 1.9 Hz), 6.96 (1H, d, J=8.3, 2.3 Hz), 5.09 (2H, s), 4.14 (1H, m), 4.04 (1H, m), 2.23 (2H, m), 1.86 (3H, m), 1.62 (1H, m), 1.33 (3H, m), 1.20 (6H, d, J=6.4 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	642 (M+1)	

表 244

実施例番号	398	1H NMR (δ) ppm
		8.41 (1H, d, J=8.1Hz), 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.17 (1H, d, J=1.8Hz), 8.12 (1H, d, J=8.4Hz), 8.01-7.95 (2H, m), 7.67-7.62 (2H, m), 7.55-7.51 (3H, m), 7.19 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.13 (2H, s), 4.10-4.00 (2H, m), 2.32-2.13 (4H, m), 1.71-1.60 (1H, m), 1.49-1.14 (3H, m), 1.21 (3H, s), 1.19 (3H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	674 (M+1)	

実施例番号	399	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.39 (1H, d, J=7.7Hz), 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.16 (1H, d, J=1.8Hz), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz), 8.00-7.95 (2H, m), 7.69-7.61 (2H, m), 7.54-7.46 (3H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.1, 2.2Hz), 7.04 (1H, dd, J=8.8, 2.2Hz), 5.13 (2H, s), 4.20-4.02 (2H, m), 2.33-2.13 (2H, brm), 1.97-1.80 (4H, m), 1.72-1.61 (1H, m), 1.44-1.13 (3H, m), 1.21 (3H, s), 1.19 (3H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	658 (M+1)	

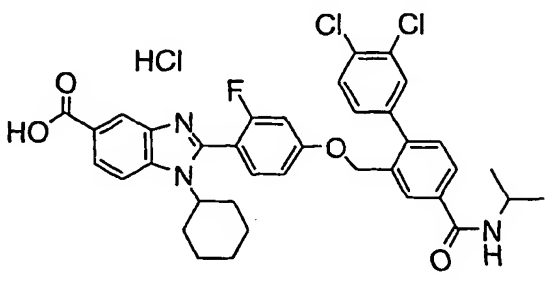
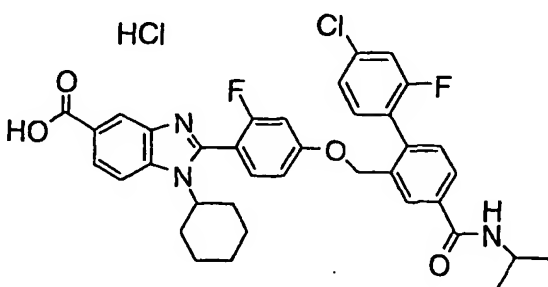
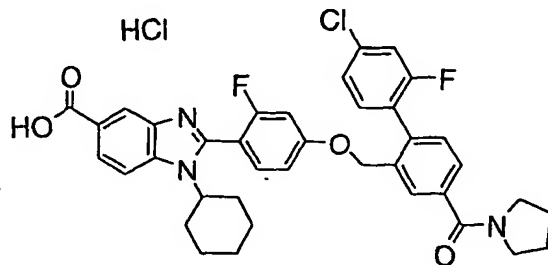
実施例番号	400	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.39 (1H, d, J=7.7Hz), 8.29 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=1.5Hz), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz), 7.98 (2H, m), 7.73 (2H, m), 7.64 (1H, t, J=8.4Hz), 7.52 (1H, d, J=8.0Hz), 7.46 (1H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 7.18 (1H, dd, J=11.9, 2.0Hz), 7.05 (1H, dd, J=8.6, 2.4Hz), 5.14 (2H, s), 4.13 (2H, m), 2.22 (2H, m), 1.88 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.34 (3H, m), 1.20 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	642 (M+1)	

表 245

実施例番号	401	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.38 (1H, d, J=7.8Hz), 8.28 (1H, s), 8.20-8.05 (2H, m), 8.00-7.90 (2H, m), 7.65-7.30 (5H, m), 7.09 (1H, d, J=12.3Hz), 6.97 (1H, d, J=10.2Hz), 5.09 (2H, s), 4.20-4.00 (2H, m), 2.30-2.10 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.40-1.10 (3H, m), 1.19 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	658 (M+1)	

実施例番号	402	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.25 (1H, s), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 7.91 (1H, d, J=8.7Hz), 7.83 (1H, s), 7.70-7.35 (6H, m), 7.04 (1H, d, J=12.0Hz), 6.93 (1H, d, J=8.4Hz), 5.09 (2H, s), 4.00 (1H, m), 3.60-3.40 (4H, m), 2.30-2.10 (2H, m), 1.45-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	670 (M+1)	

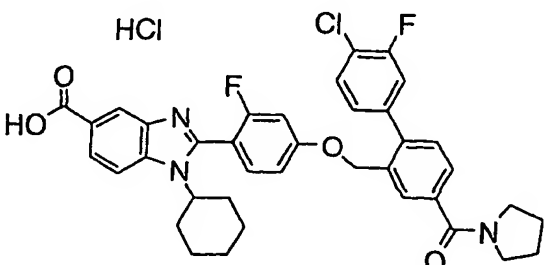
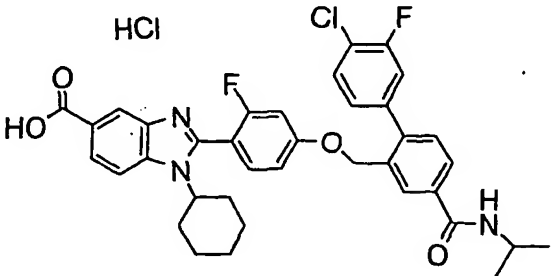
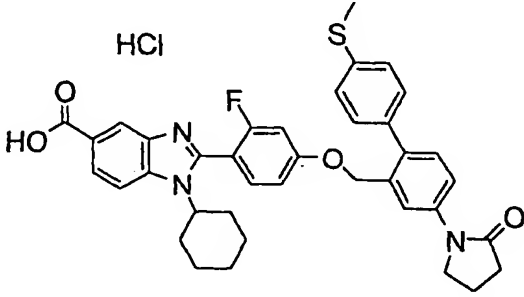
実施例番号	403	1H NMR ( $\delta$ ) ppm
		400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.25 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.4Hz), 7.92 (1H, d, J=9.2Hz), 7.79 (1H, s), 7.66-7.49 (4H, m), 7.42 (1H, d, J=7.6Hz), 7.31-7.28 (1H, m), 7.14 (1H, d, J=11.3Hz), 6.99 (1H, d, J=8.8Hz), 5.13 (2H, s), 4.02 (1H, m), 3.54-3.33 (4H, m), 2.29-2.08 (2H, m), 1.93-1.73 (8H, m), 1.67-1.52 (1H, m), 1.48-1.11 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	670 (M+1)	

表 246

実施例番号	404	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d6 8.41 (1H, d, J=7.6Hz), 8.32 (1H, d, J=1.5Hz), 8.20 (1H, d, J=8.6Hz), 8.17 (1H, d, J=1.7Hz), 8.00 (1H, dt, J=8.8Hz, 1.5Hz), 7.71-7.64 (2H, m), 7.54 (1H, dd, J=10.3Hz, 1.9Hz), 7.32 (1H, dd, J=8.2Hz, 1.9Hz), 7.22 (1H, dd, J=12.1Hz, 2.3Hz), 7.08 (1H, dd, J=8.6Hz, 2.3Hz), 5.17 (2H, s), 4.15 (1H, m), 2.31-2.14 (2H, m), 1.99-1.70 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.46-1.20 (3H, m), 1.19 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	658 (M+1)	

実施例番号	405	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, s), 8.19 (1H, d, J=9.0Hz), 8.03-7.98 (2H, m), 7.75 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.4Hz), 7.67 (1H, t, J=8.6Hz), 7.40-7.36 (3H, m), 7.32 (2H, d, J=8.4Hz), 7.19 (1H, d, J=2.1Hz, 12.3Hz), 7.07 (1H, d, J=2.1Hz, 8.7Hz), 5.11 (2H, s), 4.12 (1H, m), 4.12 (1H, m), 3.90 (2H, t, J=6.9Hz), 2.54 (2H, t, J=8.1Hz), 2.50 (3H, s), 2.40-2.05 (4H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	650 (M+1)	

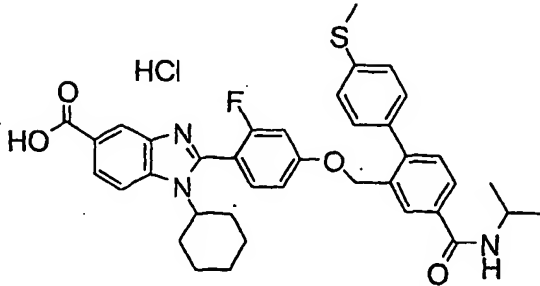
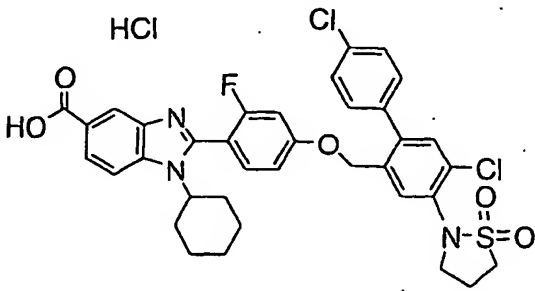
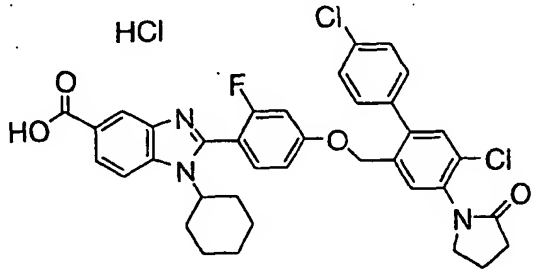
実施例番号	406	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.34 (1H, d, J=7.7Hz), 8.29 (1H, s), 8.15 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz), 7.97 (2H, d, J=9.2Hz), 7.63 (1H, t, J=8.8Hz), 7.47-7.31 (5H, m), 7.18 (1H, dd, J=12.4, 2.2Hz), 7.06 (1H, dd, J=12.4, 2.2Hz), 5.13 (2H, s), 4.13 (2H, m), 1.96 (2H, m), 1.87 (4H, m), 1.62 (1H, m), 1.34 (3H, m), 1.20 (6H, d, J=6.2Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	652 (M+1)	

表 247

実施例番号	407	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, d, J=1.4Hz), 8.20 (1H, d, J=8.8Hz), 8.01 (1H, dd, J=1.6 Hz, 8.8Hz), 7.90 (1H, s), 7.67 (1 H, t, J=8.4Hz), 7.61 (1H, s), 7.5 5-7.50 (4H, m), 7.21 (1H, dd, J=2 .3Hz, 12.0Hz), 7.06 (1H, dd, J=2 .2Hz, 8.7Hz), 5.10 (2H, s), 4.11 (1H, m), 3.78 (2H, t, J=6.7Hz), 3 .47 (2H, t, J=7.4Hz), 2.54-2.48 (2H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00 -1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m) , 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	708 (M+1)	

実施例番号	408	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d6 8.32 (1H, d, J=1.6Hz), 8.21 (1H, d, J=8.8Hz), 8.02 (1H, dd, J=1.6 Hz, 8.8Hz), 7.76 (1H, s), 7.68 (1 H, t, J=8.5Hz), 7.59 (1H, s), 7.5 4-7.51 (4H, m), 7.21 (1H, dd, J=2 .4Hz, 12.1Hz), 7.07 (1H, dd, J=2 .4Hz, 8.8Hz), 5.08 (2H, s), 4.11 (1H, m), 3.77 (2H, t, J=6.9Hz), 2 .47 (2H, t, J=8.0Hz), 2.40-2.10 (4H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.70 -1.60 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	672 (M+1)	

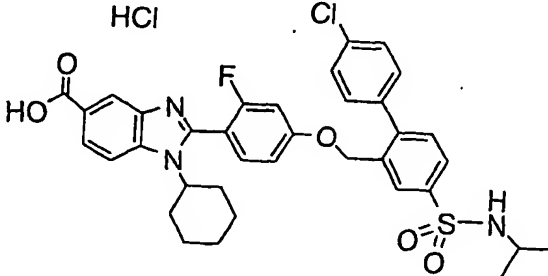
実施例番号	409	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, d, J=1 .5Hz), 8.20-8.85 (4H, m), 7.75 (1H, d, J=6.9Hz), 7.70-7.45 (6H, m), 7.13 (1H, dd, J=12.0Hz, 2.1H z), 7.00 (1H, dd, J=8.7Hz), 2.1H z), 5.22 (2H, s), 4.05 (1H, m), 3. 40-3.20 (1H, m), 2.30-2.10 (2H, m), 2.00-1.55 (5H, m), 1.45-1.1 0 (3H, m), 1.00 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	676 (M+1)	



表 248

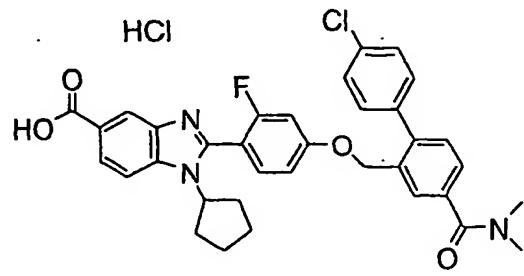
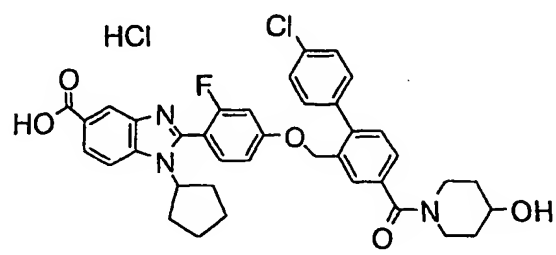
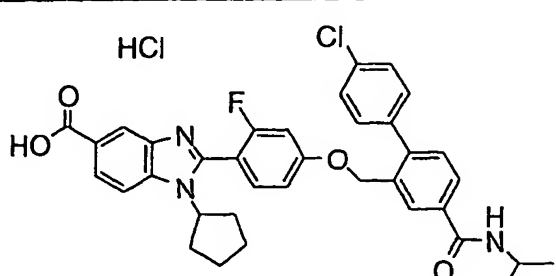
実施例番号	410	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.00 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, d, J=8.7Hz), 7.70 (1H, s), 7.65 (1H, t, J=8.4Hz), 7.53 (2H, d, J=8.4Hz), 7.49 (2H, d, J=8.7Hz), 7.45-7.41 (2H, m), 7.16 (1H, d, J=12.0Hz), 7.04 (1H, d, J=8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.68 (1H, quint, J=8.4Hz), 3.02, 2.98 (6H, s), 2.30-1.85 (6H, m), 1.80-1.50 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	612 (M+1)	
実施例番号	411	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 7.99 (1H, d, J=9.0Hz), 7.87 (1H, d, J=8.7Hz), 7.67 (1H, s), 7.64 (1H, t, J=8.7Hz), 7.53 (2H, d, J=8.7Hz), 7.49 (2H, d, J=7.5Hz), 7.45-7.41 (2H, m), 7.15 (1H, d, J=12.3Hz), 7.02 (1H, d, J=8.4Hz), 5.15 (2H, s), 4.67 (1H, quint, J=8.7Hz), 4.02 (1H, m), 3.76 (1H, m), 3.55 (1H, m), 3.22 (2H, m), 2.40-1.20 (12H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	668 (M+1)	
実施例番号	412	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.38 (1H, d, J=7.5Hz), 8.33 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.98 (1H, d, J=9.0Hz), 7.91 (1H, d, J=8.4Hz), 7.67 (1H, t, J=8.4Hz), 7.53 (2H, d, J=8.7Hz), 7.48 (2H, d, J=8.7Hz), 7.46 (1H, d, J=8.1Hz), 7.18 (1H, d, J=11.7Hz), 7.06 (1H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.70 (1H, quint, J=8.4Hz), 4.13 (1H, sept, J=6.6Hz), 2.30-1.85 (6H, m), 1.80-1.50 (2H, m), 1.16 (6H, d, J=6.3Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	

表 249

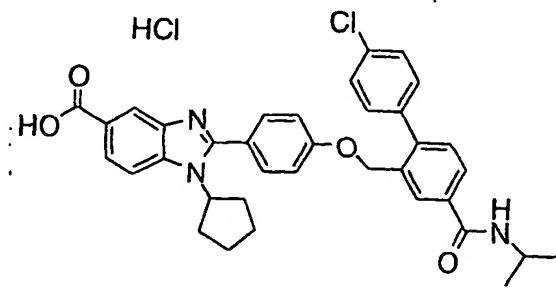
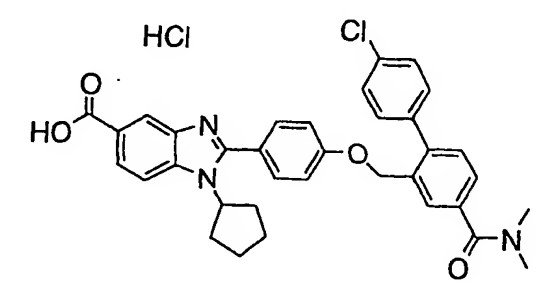
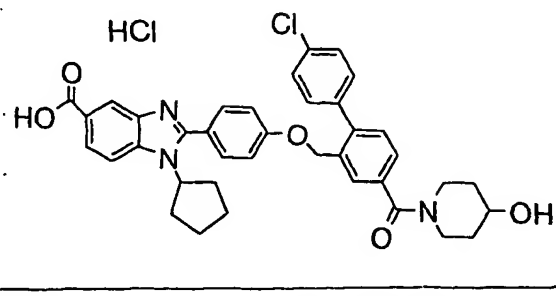
実施例番号	413	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.39 (1H, d, J=7.5Hz), 8.31 (1H, d, J=1.5Hz), 8.16 (1H, d, J=1.9Hz), 8.06 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7.99-7.95 (2H, m), 7.76 and 7.24 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.53 and 7.50 (4H, A'B'q, J=9.1Hz), 7.46 (1H, d, J=8.3Hz), 5.14 (2H, s), 4.94 (1H, quint, J=9.0Hz), 4.19-4.08 (1H, m), 2.32-2.11 (4H, brm), 2.10-1.95 (2H, brm), 1.78-1.62 (2H, brm), 1.26 (3H, s), 1.18 (3H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	608 (M+1)	
実施例番号	414	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.5Hz), 8.06 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.97 (1H, d, J=8.7Hz), 7.75 and 7.22 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.70 (1H, d, J=1.9Hz), 7.53 (1H, dd, J=7.9, 1.9Hz), 7.52 (4H, s), 7.43 (1H, d, J=7.9Hz), 5.15 (2H, s), 4.93 (1H, quint, J=8.9Hz), 3.01 (3H, s), 2.97 (3H, s), 2.32-2.11 (4H, brm), 2.09-1.94 (2H, brm), 1.77-1.62 (2H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	594 (M+1)	
実施例番号	415	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.5Hz), 8.06 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.75 and 7.22 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.67 (1H, d, J=1.5Hz), 7.52 (4H, s), 7.49 (1H, dd, J=7.9, 1.5Hz), 7.43 (1H, d, J=8.9Hz), 5.16 (2H, s), 4.93 (1H, quint, J=8.9Hz), 3.76 (1H, brs), 3.55 (2H, brs), 3.22 (2H, brs), 2.31-2.11 (4H, brm), 2.16-1.95 (2H, brm), 1.88-1.62 (4H, brm), 1.48-1.28 (2H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	650 (M+1)	

表 250

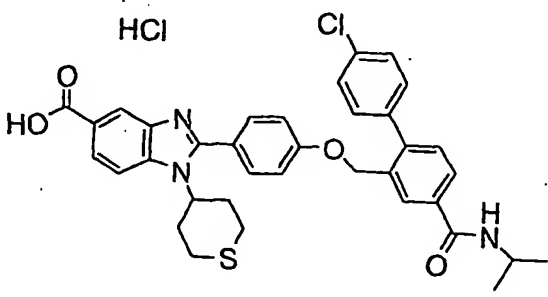
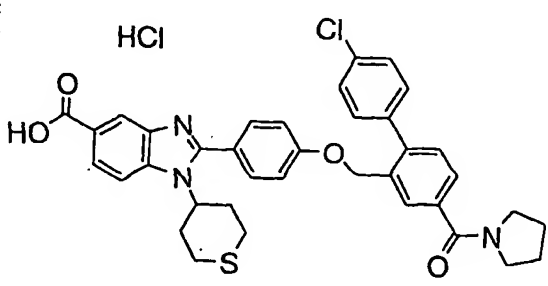
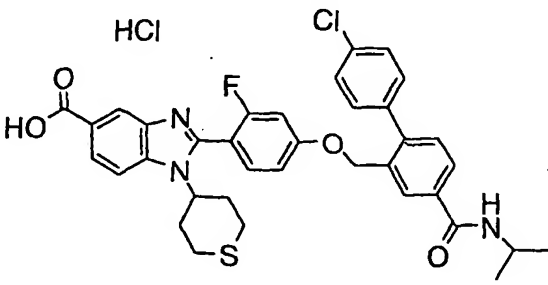
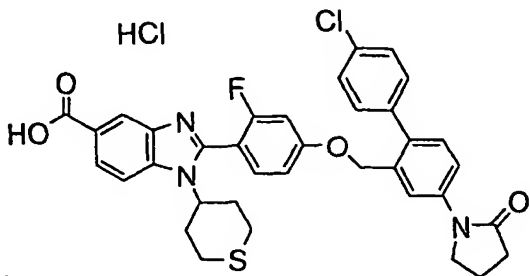
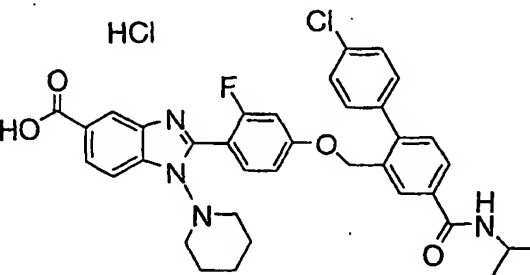
実施例番号	416	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		300MHz, DMSO-d6 8.38 (1H, d, J=7.7Hz), 8.30 (1H, s), 8.20-7.90 (4H, m), 7.72 (2H, d, J=8.7Hz), 7.60-7.40 (5H, m), 7.22 (2H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.47 (1H, m), 4.15 (1H, m), 2.90-2.70 (4H, m), 2.60-2.30 (4H, m), 1.19 (6H, d, J=6.5Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	
実施例番号	417	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		400MHz, DMSO-d6 8.33 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.6Hz), 8.10 (1H, d, J=8.6Hz), 7.82 (1H, d, J=1.4Hz), 7.74 (2H, d, J=8.7Hz), 7.64 (1H, dd, J=8.0Hz, 1.7Hz), 7.55-7.50 (4H, m), 7.43 (1H, d, J=7.8Hz), 7.24 (1H, d, J=8.7Hz), 5.16 (2H, s), 4.49 (1H, m), 3.60-3.40 (4H, m), 2.90-2.70 (4H, m), 2.60-2.30 (4H, m), 2.20-1.80 (4H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	652 (M+1)	
実施例番号	418	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		400MHz, DMSO-d6 8.34 (1H, d, J=7.6Hz), 8.25 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=1.3Hz), 7.90-8.00 (3H, m), 7.59 (1H, t, J=8.6Hz), 7.40-7.55 (5H, m), 7.12 (1H, d, J=11.9Hz), 7.00 (1H, d, J=8.6Hz), 5.08 (2H, s), 4.30-4.10 (2H, m), 2.80-2.65 (4H, m), 2.45-2.30 (2H, m), 1.15 (6H, d, J=4.8Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	658 (M+1)	

表 251

実施例番号	419	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		400MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.05-7.95 (3H, m), 7.80-7.75 (1H, m), 7.63 (1H, t, J =8.6Hz), 7.55-7.35 (5H, m), 7.1 5 (1H, dd, J=12.1Hz, 2.1Hz), 7.0 3 (1H, dd, J=8.7Hz, 2.3Hz), 5.10 (2H, s), 4.23 (1H, m), 3.90 (2H, t , J=7.0Hz), 2.95-2.70 (4H, m), 2 .60-2.35 (4H, m), 2.30-2.00 (4H , m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	656 (M+1)	

実施例番号	420	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		300Mz, DMSO-d6 8.37 (1H, d, J=7.5Hz), 8.28 (1H, d, J=1.5Hz), 8.17 (1H, d, J=1.5H z), 8.13 (1H, d, J=8.7Hz), 7.97 ( 1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.94 (1H, dd, J=8.7, 1.5Hz), 7.61 (1H, t, J =8.7Hz), 7.51 and 7.49 (4H, ABq, J=8.9Hz), 7.46 (1H, d, J=8.1Hz) , 7.08 (1H, dd, J=12.4, 2.3Hz), 6 .97 (1H, dd, J=8.7, 2.3Hz), 5.10 (2H, s), 4.20-4.08 (1H, m), 3.62 -3.56 (2H, brm), 3.13-3.10 (2H, brm), 1.79-1.60 (3H, brm), 1.54 -1.34 (3H, brm), 1.21 (3H, s), 1. 18 (3H, s)
純度	> 90% (NMR)	
MS	641 (M+1)	

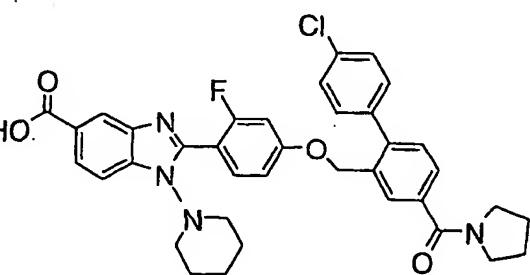
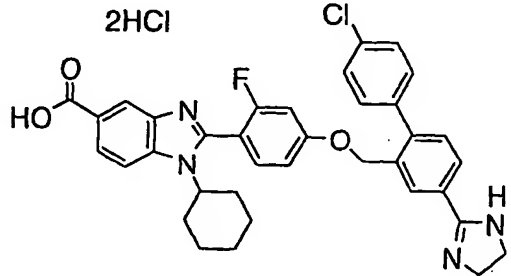
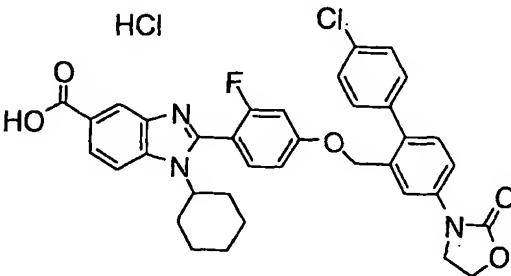
実施例番号	421	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.24 (1H, d, J=1.5Hz), 8.02 (1H, d, J=8.7Hz), 7.88 (1H, dd, J=8.7 , 1.5Hz), 7.82 (1H, d, J=1.9Hz), 7.63 (1H, dd, J=7.9, 1.9Hz), 7.5 4 (1H, t, J=8.7Hz), 7.50 (4H, s), 7.42 (1H, d, J=7.9Hz), 7.01 (1H, dd, J=12.0, 2.3Hz), 6.91 (1H, dd , J=8.7, 2.3Hz), 5.11 (2H, s), 3. 63-3.41 (6H, m), 3.07-3.04 (2H, brm), 1.95-1.79 (4H, brm), 1.77 -1.57 (3H, brm), 1.50-1.32 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	653 (M+1)	

表 252

実施例番号	422	1H NMR (δ) ppm
 <p>2HCl</p>		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 10.99(2H, s), 8.44(1H, s), 8.30(1H, s), 8.18(1H, d, J=8.7Hz), 8.14(1H, d, J=8.7Hz), 7.98(1H, d, J=9.0Hz), 7.70-7.66(2H, m), 7.57(2H, d, J=8.7Hz), 7.54(2H, d, J=8.7Hz), 7.21(1H, d, J=12.0Hz), 7.09(1H, d, J=8.4Hz), 5.19(2H, s), 4.05(4H, s), 2.40-2.18(2H, m), 2.15-1.80(4H, m), 1.75-1.55(1H, m), 1.50-1.20(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	623 (M+1)	

実施例番号	423	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.27(1H, s), 8.05(1H, d, J=8.7Hz), 7.93(1H, d, J=8.7Hz), 7.90(1H, s), 7.70(1H, d, J=8.4Hz), 7.59(1H, t, J=8.4Hz), 7.50(2H, d, J=9.0Hz), 7.45(2H, d, J=8.7Hz), 7.41(1H, d, J=8.4Hz), 7.12(1H, d, J=12.0Hz), 7.00(1H, d, J=8.7Hz), 5.10(2H, s), 4.49(2H, t, J=7.8Hz), 4.14(2H, t, J=8.0Hz), 4.04(1H, m), 2.40-2.10(2H, m), 2.00-1.50(5H, m), 1.45-1.20(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

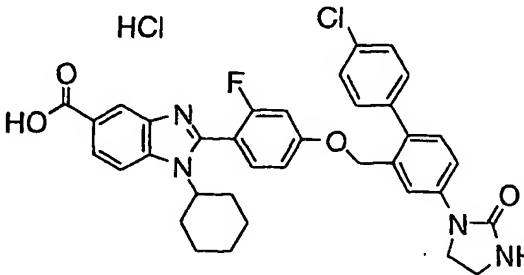
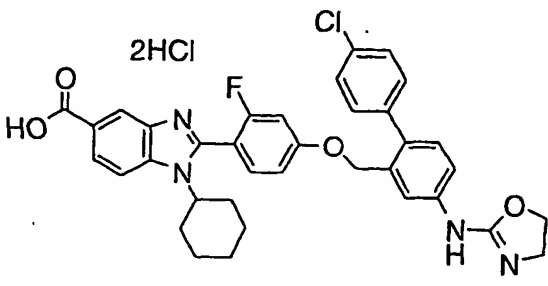
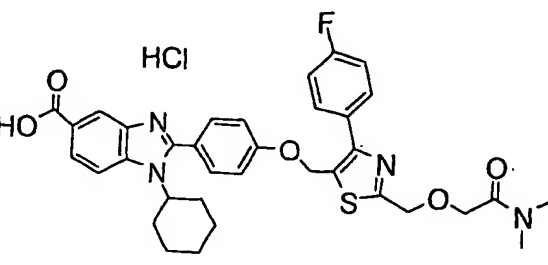
実施例番号	424	1H NMR (δ) ppm
 <p>HCl</p>		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.30(1H, s), 8.14(1H, d, J=8.4Hz), 7.98(1H, d, J=9.3Hz), 7.89(1H, s), 7.68(1H, d, J=8.4Hz), 7.62(1H, d, J=9.0Hz), 7.48(2H, d, J=8.4Hz), 7.43(2H, d, J=8.4Hz), 7.33(1H, d, J=8.4Hz), 7.16(1H, d, J=12.0Hz), 7.04(1H, d, J=9.0Hz), 5.07(2H, s), 4.10(1H, m), 3.92(2H, t, J=8.0Hz), 3.45(2H, t, J=8.0Hz), 2.40-2.10(2H, m), 2.00-1.50(5H, m), 1.45-1.20(3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	639 (M+1)	

表 253

実施例番号	425	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 9.05 (1H, s), 8.30 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.8Hz), 7.99 (1H, d, J=8.6Hz), 7.72 (1H, s), 7.64 (1H, t, J=8.6Hz), 7.52 (1H, d, J=8.4Hz), 7.47 (2H, d, J=8.7Hz), 7.42 (2H, d, J=8.6Hz), 7.25 (1H, d, J=12.2Hz), 7.04 (1H, d, J=8.6Hz), 6.60 (1H, brs), 5.05 (2H, s), 4.10 (1H, m), 3.68 (2H, t, J=6.1Hz), 3.45 (2H, t, J=6.1Hz), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.55 (5H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	639 (M+1)	

実施例番号	426	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.32 (1H, s), 8.24 (1H, d, J=8.7Hz), 8.03 (1H, d, J=8.7Hz), 7.78-7.73 (4H, m), 7.38-7.32 (4H, m), 5.52 (2H, s), 4.88 (2H, s), 4.40 (2H, s), 4.37 (1H, m), 2.92, 2.84 (6H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	643 (M+1)	

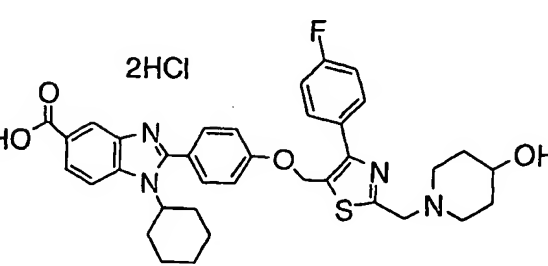
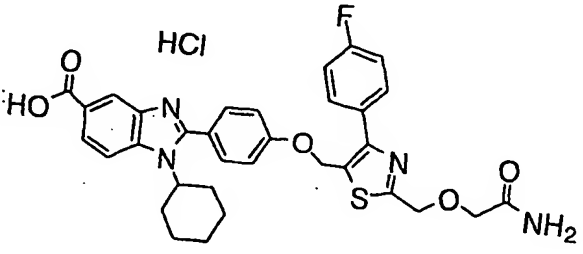
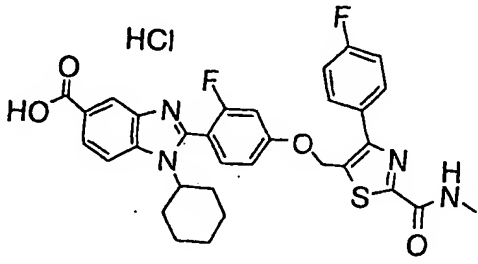
実施例番号	427	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 11.26 (1H, brs), 8.35 (1H, s), 8.27 (1H, d, J=9.0Hz), 8.05 (1H, d, J=8.4Hz), 7.83-7.78 (4H, m), 7.42-7.35 (4H, m), 5.57 (2H, s), 4.77, 4.73 (2H, s), 4.37 (1H, m), 3.95 (1H, s), 3.70-3.00 (4H, m), 2.40-1.00 (14H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	641 (M+1)	

表 254

実施例番号	428	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=9.0Hz), 8.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.79-7.73 (4H, m), 7.38-7.31 (6H, m), 5.53 (2H, s), 4.90 (2H, s), 4.37 (1H, m), 4.05 (2H, s), 2.40-2.18 (2H, m), 2.15-1.95 (2H, m), 1.90-1.80 (2H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	615 (M+1)	

実施例番号	429	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.88 (1H, q, J=4.5Hz), 8.33 (1H, d, J=1.5Hz), 8.18 (1H, d, J=8.7Hz), 8.01 (1H, dd, J=1.5Hz, 8.7Hz), 7.89-7.83 (2H, m), 7.50-7.34 (3H, m), 7.20 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.4Hz), 5.61 (2H, s), 4.13 (1H, m), 2.84 (3H, d, J=4.8Hz), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	603 (M+1)	

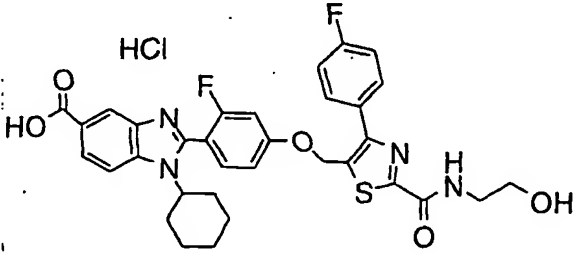
実施例番号	430	1H NMR (δ) ppm
		400MHz, DMSO-d6 8.79 (1H, t, J=5.9Hz), 8.31 (1H, s), 8.15 (1H, d, J=8.7Hz), 7.99 (1H, d, J=8.8Hz), 7.87 (1H, d, J=8.1Hz), 7.85 (1H, d, J=8.7Hz), 7.70 (1H, t, J=8.4Hz), 7.42-7.33 (3H, m), 7.18 (1H, d, J=8.8Hz), 5.60 (2H, s), 4.11 (1H, m), 3.62-3.54 (4H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	633 (M+1)	

表 255

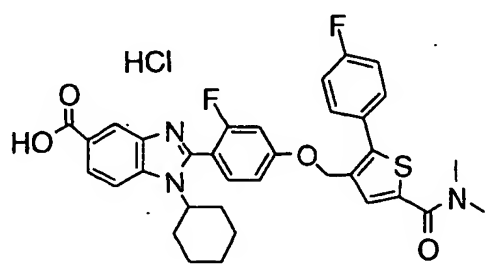
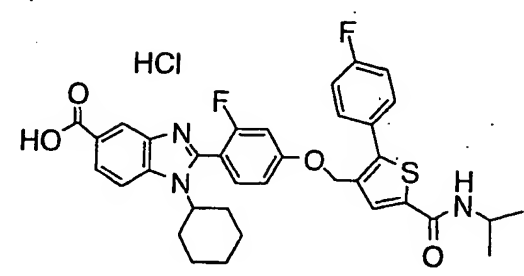
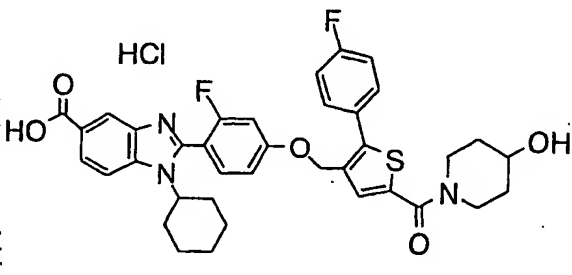
実施例番号	431	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.31 (1H, s), 8.16 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.99 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.74-7.60 (4H, m), 7.37 (2H, t, J=8.8 Hz), 7.28 (1H, dd, J=2.2 Hz, 12.2 Hz), 7.14 (1H, dd, J=2.2 Hz, 8.6 Hz), 5.17 (2H, s), 4.10 (1H, m), 3.15 (6H, brs), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	616 (M+1)	
実施例番号	432	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.45 (1H, d, J=7.7 Hz), 8.32 (1H, s), 8.19 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.02-7.99 (2H, m), 7.70 (1H, t, J=8.6 Hz), 7.60 (2H, dd, J=5.4 Hz, 8.7 Hz), 7.37 (2H, t, J=8.8 Hz), 7.27 (1H, dd, J=2.3 Hz, 12.2 Hz), 7.14 (1H, dd, J=2.2 Hz, 8.7 Hz), 5.16 (2H, s), 4.20-4.00 (2H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m), 1.18 (6H, d, J=6.6 Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	630 (M+1)	
実施例番号	433	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.31 (1H, d, J=1.4 Hz), 8.15 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.98 (1H, dd, J=1.4 Hz, 8.7 Hz), 7.68-7.60 (4H, m), 7.36 (2H, t, J=8.8 Hz), 7.28 (1H, d, J=2.2 Hz, 12.2 Hz), 7.15 (1H, d, J=2.2 Hz, 8.6 Hz), 5.17 (2H, s), 4.10 (1H, m), 4.05-3.90 (2H, m), 3.85-3.70 (1H, m), 3.55-3.25 (2H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (6H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (5H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	672 (M+1)	



表 256

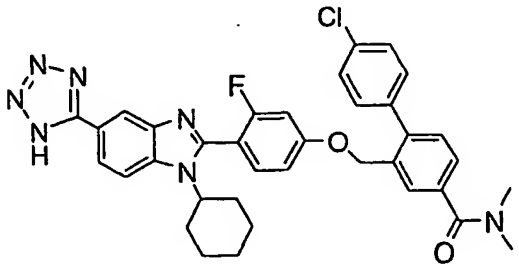
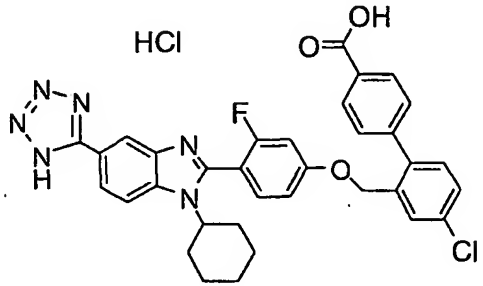
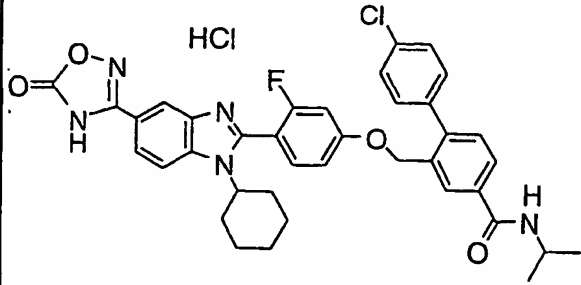
実施例番号	434	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.45 (1H, d, J=1.5Hz), 8.26 (1H, d, J=8.8Hz), 8.10 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 7.72 (1H, d, J=1.5Hz), 7.64 (1H, t, J=8.6Hz), 7.56-7.48 (5H, m), 7.44 (1H, d, J=7.7Hz), 7.18 (1H, dd, J=12.3, 2.4Hz), 7.04 (1H, dd, J=8.6, 2.4Hz), 5.15 (2H, s), 4.08 (1H, brt, J=11.7Hz), 3.02 (3H, s), 2.99 (3H, s), 2.34-2.17 (2H, brm), 1.97-1.81 (4H, brm), 1.70-1.60 (1H, brm), 1.49-1.21 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	650 (M+1)	
実施例番号	435	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.42 (1H, d, J=1.5Hz), 8.24 (1H, d, J=8.8Hz), 8.08 (1H, dd, J=8.8, 1.5Hz), 8.00 (2H, d, J=8.8Hz), 7.79 (1H, d, J=7.8Hz), 7.62 (1H, t, J=8.4Hz), 7.61-7.55 (3H, m), 7.44 (1H, d, J=8.1Hz), 7.16 (1H, dd, J=12.1, 2.6Hz), 7.02 (1H, dd, J=8.4, 2.6Hz), 5.12 (2H, s), 4.07 (1H, brt, J=12.5Hz), 2.33 (2H, brm), 1.96-1.79 (4H, brm), 1.71-1.61 (1H, brm), 1.49-1.21 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	623 (M+1)	
実施例番号	436	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.41 (1H, d, J=7.7Hz), 8.30-8.26 (2H, m), 8.18 (1H, d, J=1.4Hz), 7.99 (1H, dd, J=1.7Hz, 8.0Hz), 7.89 (1H, d, J=10.1Hz), 7.67 (1H, t, J=8.8Hz), 7.55-7.45 (5H, m), 7.20 (1H, d, J=12.2Hz), 7.07 (1H, dd, J=2.1Hz, 8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4.18-4.11 (2H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m), 1.20 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	680 (M+1)	

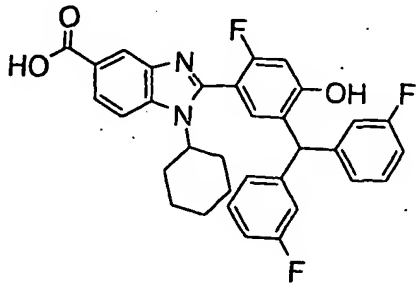
表 257

実施例番号	437	1H NMR (δ) ppm
純度	> 90% (NMR)	
MS	580 (M+1)	

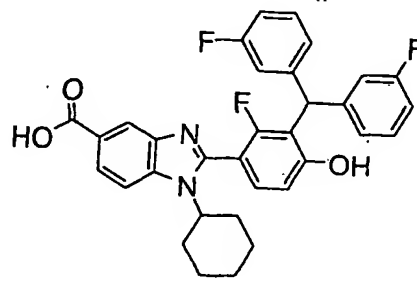
実施例番号	438	1H NMR (δ) ppm
純度	> 90% (NMR)	
MS	607 (M+1)	

実施例番号	439	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, CDCl3 8.60 (1H, d, J=1.5Hz), 8.05 (1H, d, J=1.6Hz, 8.7Hz), 7.70 (1H, d, J=8.7Hz), 7.62 (2H, d, J=8.2Hz), 7.49 (2H, d, J=8.2Hz), 7.31 (2H, d, J=8.8Hz), 7.27-7.23 (2H, m), 7.06 (2H, t, J=8.6Hz), 6.80 (2H, d, J=8.8Hz), 5.05 (2H, s), 4.38 (1H, m), 3.06 (6H, s), 2.45-2.20 (2H, m), 2.10-1.70 (5H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	591 (M+1)	

表 258

実施例番号	440	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.20 (1H, s), 7.86 (2H, m), 7.39 (1H, d, J=7.9Hz), 7.34 (1H, d, J=7.9Hz), 7.07 (2H, dt, J=2.3Hz, 8.6Hz), 6.98-6.88 (5H, m), 6.83 (1H, d, J=8.3Hz), 5.91 (1H, s), 3.96 (1H, m), 2.30-1.95 (2H, m), 1.90-1.50 (4H, m), 1.40-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	557 (M+1)	

実施例番号	441	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.24 (1H, d, J=1.4Hz), 8.01 (1H, d, J=8.8Hz), 7.91 (1H, dd, J=1.4Hz, 8.7Hz), 7.47 (1H, t, J=8.4Hz), 7.43-7.35 (2H, m), 7.15-7.01 (5H, m), 6.92 (2H, d, J=10.4Hz), 6.11 (1H, s), 3.90 (1H, m), 2.30-1.95 (2H, m), 1.90-1.50 (4H, m), 1.40-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	557 (M+1)	

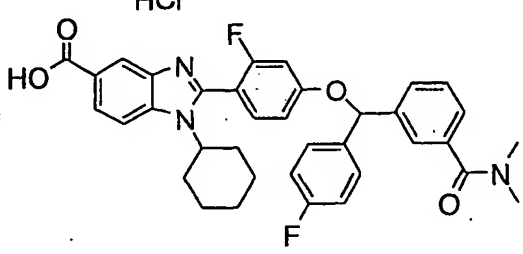
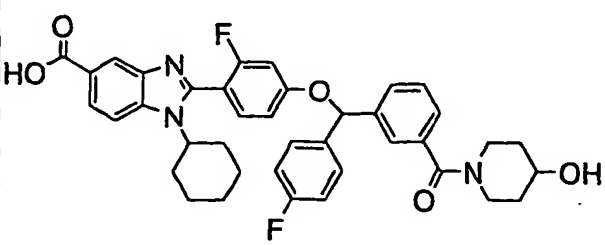
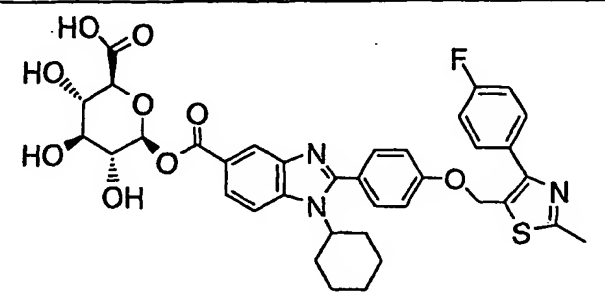
実施例番号	442	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.26 (1H, d, J=1.5Hz), 8.11 (1H, d, J=8.9Hz), 7.96 (1H, dd, J=8.9, 1.5Hz), 7.65-7.57 (5H, m), 7.47 (1H, t, J=7.7Hz), 7.35 (1H, d, J=7.6Hz), 7.30-7.22 (3H, m), 7.16 (1H, dd, J=8.7, 2.3Hz), 6.88 (1H, s), 4.04 (1H, brt, J=11.3Hz), 2.98 (3H, s), 2.84 (3H, s), 2.30-2.10 (2H, brm), 1.94-1.75 (4H, brm), 1.68-1.57 (1H, brm), 1.45-1.14 (3H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	610 (M+1)	

表 259

実施例番号	443	1H NMR (δ) ppm
		300Mz, DMSO-d6 8.23 (1H, s), 7.98 and 7.89 (2H, ABq, J=8.8Hz), 7.62-7.06 (11H, m), 6.86 (1H, s), 4.12-3.77 (2H, brm), 3.72 (1H, brs), 3.69 (1H, brs), 3.18 (1H, brs), 3.05 (1H, brs), 2.31-2.08 (2H, brm), 1.90-1.54 (7H, brm), 1.48-1.13 (5H, brm)
純度	> 90% (NMR)	
MS	666 (M+1)	

実施例番号	444	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.36 (1H, s), 8.00 (1H, d, J=8.7Hz), 7.90 (1H, d, J=9.3Hz), 7.80-7.70 (2H, m), 7.63 (2H, d, J=8.4Hz), 7.32 (2H, t, J=8.7Hz), 7.22 (2H, d, J=8.4Hz), 5.62 (1H, d, J=7.5Hz), 5.57 (1H, brd, J=4.8Hz), 5.41 (2H, s), 5.31 (1H, m), 4.29 (1H, m), 3.84 (1H, d, J=9.0Hz), 3.50-3.20 (3H, m), 2.71 (3H, s), 2.40-2.20 (2H, m), 1.75-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	718 (M+1)	

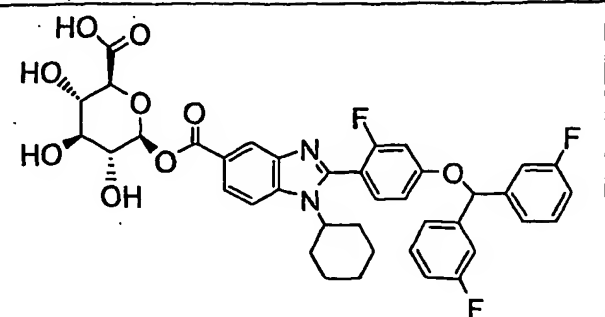
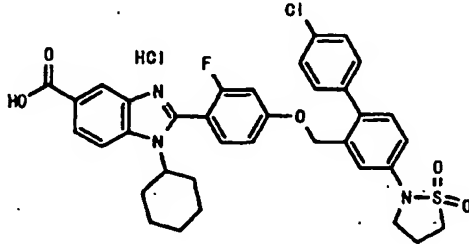
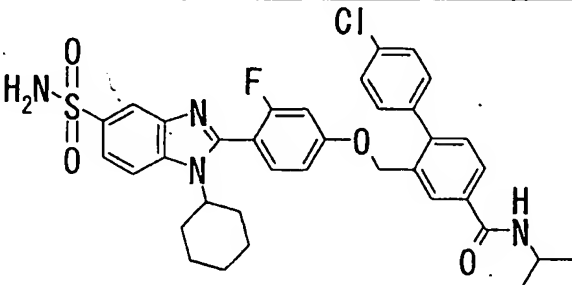
実施例番号	445	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.36 (1H, s), 8.00 (1H, d, J=8.7Hz), 7.92 (1H, d, J=9.3Hz), 7.57 (1H, t, J=8.4Hz), 7.50-7.35 (6H, m), 7.25-7.05 (4H, m), 6.82 (1H, s), 5.62 (1H, d, J=7.2Hz), 5.56 (1H, m), 5.28 (1H, brs), 3.95 (1H, m), 3.82 (1H, d, J=8.7Hz), 3.50-3.20 (3H, m), 2.30-2.05 (2H, m), 1.90-1.55 (5H, m), 1.40-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	733 (M+1)	

表 260

実施例番号	446	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=9.0Hz), 7.97 (1H, d, J=9.0Hz), 7.63 (1H, t, J=8.6Hz), 7.51-7.32 (7H, m), 7.15 (1H, d, J=12.0Hz), 7.03 (1H, d, J=9.0Hz), 5.10 (2H, s), 4.09 (1H, m), 3.82 (2H, t, J=6.3Hz), 3.56 (2H, t, J=7.4Hz), 2.45 (2H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.55 (5H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	674 (M+1)	

実施例番号	447	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.36 (1H, d, J=7.7Hz), 8.14 (2H, d, J=12.1Hz), 8.08 (1H, d, J=8.5Hz), 7.97 (1H, dd, J=1.7Hz, 8.3Hz), 7.74 (1H, dd, J=1.8Hz, 8.4Hz), 7.58-7.45 (6H, m), 7.31 (2H, s), 7.12 (1H, dd, J=2.2Hz, 12.1Hz), 7.00 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.6Hz), 5.11 (2H, s), 4.16 (1H, m), 4.02 (1H, m), 2.20 (2H, m), 1.86 (4H, m), 1.62 (1H, m), 1.21 (9H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	675 (M+1)	

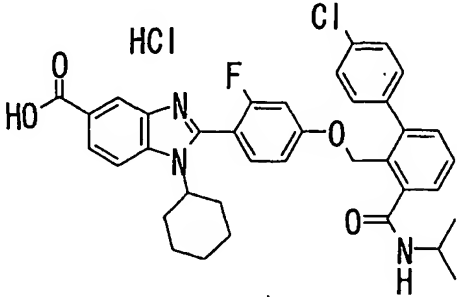
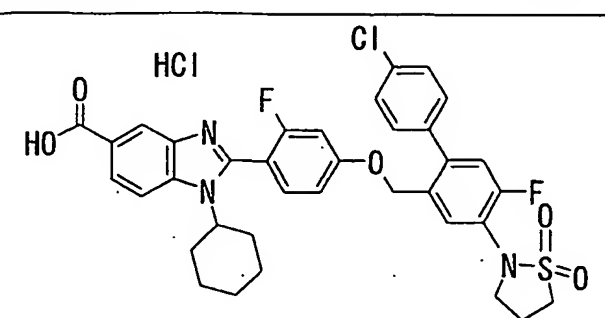
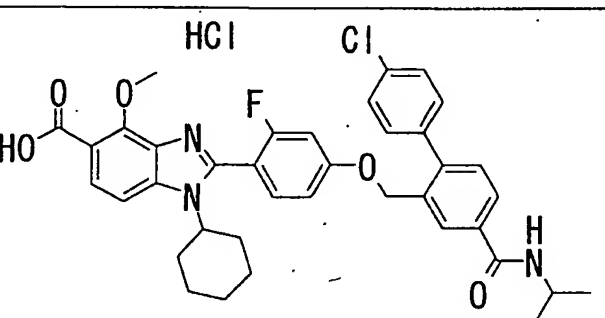
実施例番号	448	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.29 (2H, m), 8.04 (1H, d, J=8.5Hz), 7.93 (1H, dd, J=1.5Hz, 8.8Hz), 7.60-7.42 (8H, m), 7.05 (1H, dd, J=2.2Hz, 12.1Hz), 6.95 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.6Hz), 5.11 (2H, s), 4.07-3.90 (2H, m), 2.28-2.19 (2H, m), 1.88-1.84 (4H, m), 1.67-1.62 (1H, m), 1.40-1.26 (3H, m), 1.04 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

表 261

実施例番号	449	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.31 (1H, s), 8.17 (1H, d, J=8.7Hz), 8.00 (1H, d, J=8.7Hz), 7.78 (1H, d, J=8.1Hz); 7.66 (1H, t, J=8.7Hz), 7.55-7.45 (4H, m), 7.40 (1H, d, J=11.7Hz), 7.19 (1H, d, J=12.3Hz), 7.05 (1H, d, J=8.7Hz), 5.07 (2H, s), 4.10 (1H, m), 3.85 (2H, t, J=6.6Hz), 3.47 (2H, t, J=7.5Hz), 2.60-2.50 (2H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	692 (M+1)	

実施例番号	450	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.37 (1H, d, J=7.8Hz), 8.15 (1H, s), 7.97 (1H, d, J=9.8Hz), 7.64-7.45 (8H, m), 7.12 (1H, d, J=12.1Hz), 7.00 (1H, d, J=8.6Hz), 5.11 (2H, s), 4.21 (3H, s), 4.18-4.05 (1H, m), 4.04-3.89 (1H, m), 2.29-2.08 (2H, m), 1.90-1.74 (4H, m), 1.68-1.58 (1H, m), 1.40-1.17 (3H, m), 1.20 (6H, d, J=6.6Hz)
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	670 (M+1)	

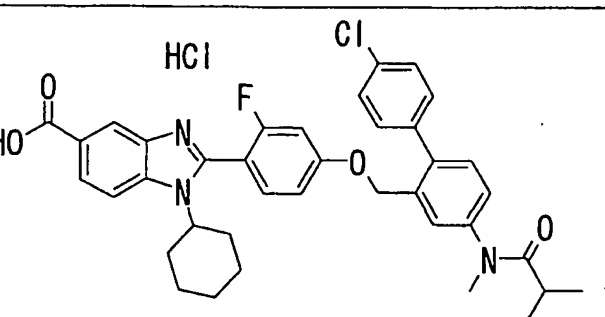
実施例番号	451	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.12 (1H, d, J=8.8Hz), 7.97 (1H, d, J=10.2Hz), 7.65-7.59 (2H, m), 7.51 (4H, s), 7.46 (2H, s), 7.15 (1H, d, J=12.2Hz), 7.01 (1H, d, J=8.6Hz), 5.15 (2H, s), 4.13-3.98 (1H, m), 3.21 (3H, s), 2.56-2.42 (1H, m), 2.30-2.15 (2H, m), 1.95-1.77 (4H, m), 1.69-1.59 (1H, m), 1.45-1.17 (3H, m), 0.96 (6H, d, J=6.5Hz)
		
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	

表 262

実施例番号	452	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 10.1 (1H, s), 8.28 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.7Hz), 7.96 (1H, d, J=11.4Hz), 7.95 (1H, s), 7.72 (1H, d, J=8.7Hz), 7.62 (1H, t, J=9.0Hz), 7.48 and 7.43 (4H, ABq, J=8.4Hz), 7.31 (1H, d, J=8.4Hz), 7.13 (1H, d, J=12.0Hz), 7.02 (1H, d, J=9.0Hz), 5.07 (2H, s), 4.14-4.00 (1H, m), 2.69-2.59 (1H, m), 2.30-2.12 (2H, m), 1.95-1.77 (4H, m), 1.71-1.57 (1H, m), 1.45-1.20 (3H, m), 1.12 (6H, d, J=6.9Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

実施例番号	453	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 11.1 (1H, brs), 8.31 (1H, d, J=9.4Hz), 8.29 (1H, s), 8.07 (1H, d, J=10.2Hz), 7.70-7.62 (3H, m), 7.31-7.23 (3H, m), 4.40-4.23 (1H, m), 4.24 (2H, s), 2.61 (3H, s), 2.34-2.14 (2H, m), 1.99-1.72 (4H, m), 1.66-1.54 (1H, m), 1.46-1.30 (1H, m), 1.27-1.08 (2H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	542 (M+1)	

実施例番号	454	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.27 (1H, d, J=1.4Hz), 8.05 (1H, d, J=8.7Hz), 7.92 (1H, d, J=8.7Hz), 7.79 (1H, d, J=7.8Hz), 7.59 (1H, t, J=8.6Hz), 7.55-7.45 (4H, m), 7.37 (1H, d, J=11.4Hz), 7.14 (1H, d, J=12.1Hz), 7.01 (1H, d, J=8.6Hz), 5.04 (2H, s), 4.10 (1H, m), 3.84 (2H, t, J=6.9Hz), 2.55-2.45 (2H, m), 2.40-2.10 (4H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	656 (M+1)	

表 263

実施例番号	455	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 10.05 (1H, brs), 8.32 (1H, d, J=1.3 Hz), 8.19 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.01 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.67 (1H, t, J=8.6 Hz), 7.50-7.41 (5H, m), 7.38-7.33 (2H, m), 7.17 (1H, dd, J=2.2 Hz, 12.2 Hz), 7.05 (1H, dd, J=2.2 Hz, 8.7 Hz), 5.10 (2H, s), 4.12 (1H, m), 3.07 (3H, s), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	648 (M+1)	

実施例番号	456	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.31 (1H, d, J=1.4 Hz), 8.17 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.00 (1H, dd, J=1.5 Hz, 8.7 Hz), 7.73 (1H, d, J=2.3 Hz), 7.66 (1H, t, J=8.6 Hz), 7.56 (1H, dd, J=2.3 Hz, 8.3 Hz), 7.50-7.47 (4H, m), 7.42 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.19 (1H, d, J=12.2 Hz), 7.06 (1H, dd, J=2.2 Hz, 8.6 Hz), 5.11 (2H, s), 4.10 (1H, m), 3.31 (3H, s), 3.03 (3H, s), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	662 (M+1)	

実施例番号	457	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.41 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.28 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=9.2 Hz), 7.96 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.87 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.61 (1H, dd, J=8.5 Hz, 8.5 Hz), 7.56-7.49 (4H, m), 7.19 (1H, dd, J=2.4 Hz, 12.2 Hz), 7.05 (1H, dd, J=2.4 Hz, 8.7 Hz), 5.18 (2H, s), 4.06-3.97 (4H, m), 2.62 (2H, t, J=8.1 Hz), 2.28-2.15 (2H, m), 2.11-2.01 (4H, m), 1.91-1.87 (4H, m), 1.64 (1H, m), 1.43-1.23 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	639 (M+1)	



表 264

実施例番号	458	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 10.19 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.14 (1H, d, J=8.8Hz), 7.98 (1H, dd, J=1.7Hz, 8.7Hz), 7.90 (1H, d, J=2.2Hz), 7.69 (1H, dd, J=2.2Hz, 8.4Hz), 7.64 (1H, dd, J=8.5Hz, 8.5Hz), 7.50-7.42 (4H, m), 7.32 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.14 (1H, dd, J=2.5Hz, 12.1Hz), 7.02 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.6Hz), 5.08 (2H, s), 4.17-4.02 (1H, m), 2.30-2.18 (2H, m), 2.08 (3H, s), 1.87-1.79 (4H, m), 1.68-1.59 (1H, m), 1.35-1.23 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	612 (M+1)	

実施例番号	459	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.29 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz), 7.96 (1H, d, J=8.6Hz), 7.64-7.58 (2H, m), 7.51 (4H, s), 7.44 (2H, s), 7.15 (1H, d, J=12.2Hz), 7.02 (1H, d, J=8.5Hz), 5.14 (2H, s), 4.12-3.95 (1H, m), 3.70 (2H, q, J=7.1Hz), 2.50 (3H, s), 2.31-2.12 (2H, m), 1.92-1.82 (4H, m), 1.69-1.57 (1H, m), 1.43-1.16 (3H, m), 1.05 (3H, t, J=7.1Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

実施例番号	460	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.28 (1H, s), 8.09 (1H, d, J=8.8Hz), 7.95 (1H, d, J=10.1Hz), 7.64-7.56 (2H, m), 7.51 (4H, ws), 7.44 (2H, s), 7.14 (1H, d, J=12.2Hz), 7.01 (1H, d, J=8.6Hz), 5.14 (2H, s), 4.12-3.95 (1H, m), 3.64 (2H, t, J=7.2Hz), 2.50 (3H, s), 2.31-2.12 (2H, m), 1.93-1.84 (4H, m), 1.69-1.59 (1H, m), 1.52-1.17 (5H, m), 0.84 (3H, t, J=7.3Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	

表 265

実施例番号	461	1H NMR (δ) ppm 400MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.8Hz), 7.99 (1H, d, J=8.8Hz), 7.69 (1H, s), 7.62 (1H, t, J=8.4Hz), 7.96-7.50 (4 H, m), 7.45 (1H, d, J=8.7Hz), 7.17 (1 H, dd, J=2.3Hz, 12.0Hz), 7.05 (1H, d d, J=2.2Hz, 8.7Hz), 5.14 (2H, s), 4. 07 (1H, m), 3.73 (2H, q, J=7.2Hz), 3. 05 (3H, s), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00- 1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (1H, m), 1.5 0-1.20 (3H, m), 1.06 (3H, t, J=7.2Hz )
純度	> 90% (NMR)	
MS	676 (M+1)	

実施例番号	462	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.30 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.7Hz), 7.98 (1H, d, J=8.7Hz), 7.70 (1H, d, J =1.8Hz), 7.63 (1H, t, J=8.4Hz), 7.5 5-7.50 (5H, m), 7.43 (1H, d, J=8.1Hz ) , 7.15 (1H, d, J=12.0Hz), 7.02 (1H, d, J=8.7Hz), 5.13 (2H, s), 4.07 (1H, m), 3.65 (2H, t, J=6.6Hz), 3.03 (3H, s), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.75 (4 H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (5H, m), 0.87 (3H, t, J=7.5Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	690 (M+1)	

実施例番号	463	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, s), 8.11 (1H, d, J=8.5Hz), 7.97 (1H, d, J=9.9Hz), 7.65 (1H, br) , 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.53-7.42 (6 H, m), 7.16 (1H, dd, J=2.2Hz, 12.1H z), 7.03 (1H, dd, J=2.0Hz, 9.0Hz), 5 .12 (2H, s), 4.04-4.00 (1H, m), 3.24 (3H, s), 2.20 (2H, m), 1.87 (7H, m), 1 .64 (1H, m), 1.41-1.28 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	626 (M+1)	

表 266

実施例番号	464	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, s), 8.09 (1H, d, J=8.8Hz), 7.95 (1H, d, J=8.8Hz), 7.73 (1H, d, J =2.2Hz), 7.63-7.39 (7H, m), 7.15 (1 H, dd, J=2.2Hz, 12.1Hz), 7.01 (1H, d d, J=2.0Hz, 8.6Hz), 5.10 (2H, s), 4. 05-3.99 (1H, m), 3.34 (3H, s), 3.23 ( 2H, q, J=7.2Hz), 2.20 (2H, m), 1.87 ( 4H, m), 1.62 (1H, m), 1.33 (3H, m), 1. 24 (3H, t, J=7.3Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	676 (M+1)	

実施例番号	465	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.29 (1H, d, J=1.5Hz), 8.11 (1H, d, J=8.8Hz), 7.98 (1H, dd, J=1.4Hz, 8 .4Hz), 7.69 (1H, d, J=2.2Hz), 7.62 (1H, dd, J=8.6Hz, 8.6Hz), 7.56-7. 47 (5H, m), 7.43 (1H, d, J=8.1Hz), 7 .16 (1H, dd, J=2.2Hz, 12.1Hz), 7.0 2 (1H, dd, J=2.4Hz, 8.7Hz), 5.13 (2 H, s), 4.09-4.02 (1H, m), 3.77 (2H, q, J=6.8Hz), 3.19 (2H, q, J=7.4Hz) , 2.25-2.21 (2H, m), 1.90-1.87 (4H , m), 1.63 (1H, m), 1.39-1.33 (3H, m , 1.27 (3H, t, J=7.4Hz), 1.06 (3H, t, J=6.9Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	690 (M+1)	

実施例番号	466	1H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d6 8.28 (1H, s), 8.10 (1H, d, J=8.4Hz) , 7.96 (1H, d, J=8.4Hz), 7.64 (1H, s , 7.61 (1H, d, J=8.4Hz), 7.50 (4H, s), 7.44 (2H, s), 7.14 (1H, d, J=12. 0Hz), 7.02 (1H, d, J=8.4Hz), 5.12 ( 2H, s), 4.12-3.95 (1H, m), 3.23 (3H , s), 2.32-2.06 (4H, m), 1.94-1.77 (4H, m), 1.70-1.59 (1H, m), 1.42-1 .18 (3H, m), 0.96 (3H, t, J=7.2Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	640 (M+1)	

表 267

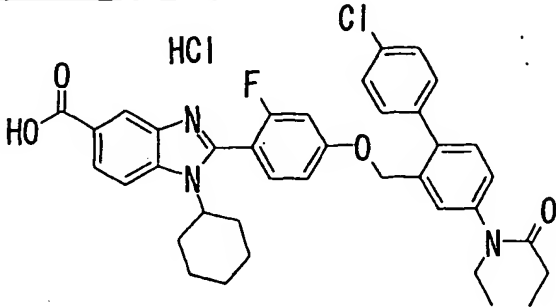
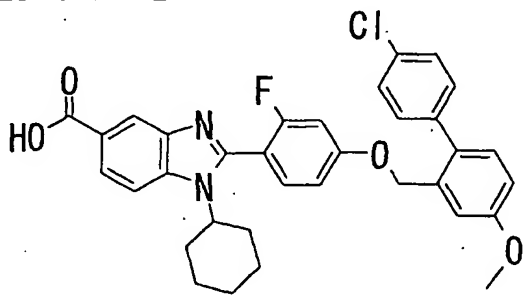
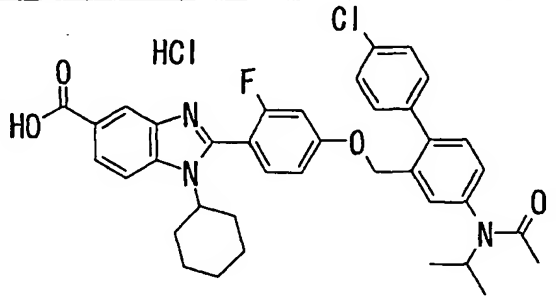
実施例番号	467	1H NMR ( $\delta$ ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.28 (1H, s), 8.08 (1H, d, J=8.7Hz), 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.60 (1H, t, J=8.4Hz), 7.59 (1H, s), 7.51 (4H, s), 7.45 and 7.42 (2H, ABq, J=8.1Hz), 7.14 (1H, d, J=12.0Hz), 7.00 (1H, d, J=8.4Hz), 5.14 (2H, s), 4.12-3.95 (1H, m), 3.70 (2H, q, J=6.9Hz), 2.30-1.98 (4H, m), 1.94-1.79 (4H, m), 1.69-1.59 (1H, m), 1.45-1.17 (3H, m), 1.05 (3H, t, J=6.9Hz), 0.94 (3H, t, J=7.5Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	
		
実施例番号	468	1H NMR ( $\delta$ ) ppm 400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.25 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.8Hz), 7.90 (1H, d, J=8.8Hz), 7.55 (1H, t, J=8.4Hz), 7.46 (2H, d, J=8.7Hz), 7.41 (2H, d, J=8.7Hz), 7.10-7.00 (2H, m), 6.98 (1H, dd, J=2.2Hz, 8.7Hz), 5.05 (2H, s), 3.98 (1H, m), 3.84 (3H, s), 2.30-2.10 (2H, m), 1.90-1.75 (4H, m), 1.70-1.60 (1H, m), 1.50-1.20 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	585 (M+1)	
		
実施例番号	469	1H NMR ( $\delta$ ) ppm 400MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.26 (1H, s), 8.02 (1H, d, J=8.8Hz), 7.93 (1H, d, J=8.8Hz), 7.60-7.50 (6H, m), 7.45 (1H, d, J=8.7Hz), 7.08 (1H, dd, J=2.3Hz, 12.0Hz), 6.97 (1H, dd, J=2.2Hz, 8.7Hz), 5.18 (2H, s), 4.85 (1H, sept, J=6.6Hz), 3.98 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.80 (4H, m), 1.75-1.55 (4H, m), 1.50-1.20 (3H, m), 1.02 (6H, d, J=6.6Hz)
純度	> 90% (NMR)	
MS	654 (M+1)	
		

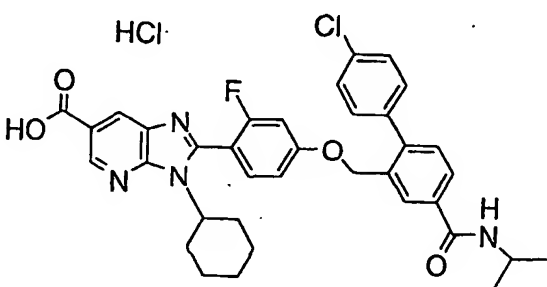
表 268

実施例番号	470	<sup>1</sup> H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 8.39 (1H, d, J=1.4Hz), 8.04 (1H, d, J=8.8Hz), 7.98 (1H, d, J=2.2Hz), 7.95 (1H, d, J=8.8Hz), 7.78 (1H, dd, J=2.3Hz, 8.5Hz), 7.57 (1H, t, J=8.6Hz), 7.50 (2H, d, J=8.8Hz), 7.45 (2H, d, J=8.8Hz), 7.39 (1H, d, J=8.4Hz), 7.10 (1H, d, J=12.1Hz), 6.98 (1H, d, J=8.6Hz), 5.65-5.60 (2H, m), 5.35 (1H, d, J=4.2Hz), 5.08 (2H, s), 4.00 (1H, m), 3.93-3.84 (3H, m), 3.50-3.30 (4H, m), 2.54 (2H, t, J=7.8Hz), 2.40-2.00 (4H, m), 1.95-1.75 (4H, m), 1.70-1.55 (1H, m), 1.45-1.15 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	814 (M+1)	

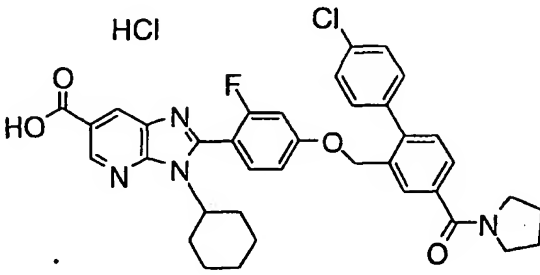
  

実施例番号	471	<sup>1</sup> H NMR (δ) ppm 300MHz, DMSO-d <sub>6</sub> 12.78 (1H, brs), 8.30 (1H, dd, J=0.9Hz, 1.5Hz), 8.22 (1H, d, J=1.5Hz), 7.95 (1H, d, J=1.8Hz), 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.85 (1H, dd, J=1.2Hz, 8.4Hz), 6.96 (1H, dd, J=0.9Hz, 1.8Hz), 4.46 (1H, m), 2.40-2.10 (2H, m), 2.00-1.20 (8H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	311 (M+1)	

表 269

実施例番号	702	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.97 (1H, d, J=1.8Hz), 8.52 (1H, d, J=2.4Hz), 8.36 (1H, d, J=7.8Hz), 8.16 (1H, s), 7.96 (1H, d, J=8.1Hz), 7.55-7.40 (5H, m), 7.14 (1H, d, J=12.6Hz), 7.01 (1H, dd, J=8.4Hz, 1.8Hz), 5.11 (2H, s), 4.20-3.95 (2H, m), 2.65-2.45 (2H, m), 1.95-1.80 (5H, m), 1.20-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	641 (M+1)	

実施例番号	703	1H NMR (δ) ppm
		300MHz, DMSO-d6 8.97 (1H, d, J=1.8Hz), 8.52 (1H, d, J=1.8Hz), 7.82 (1H, s), 7.70-7.35 (7H, m), 7.13 (1H, d, J=12.3Hz), 7.00 (1H, d, J=11.1Hz), 5.14 (2H, s), 3.60-3.35 (4H, m), 2.65-2.40 (2H, m), 2.00-2.55 (9H, m), 1.40-1.10 (3H, m)
純度	> 90% (NMR)	
MS	653 (M+1)	

## 産業上の利用可能性

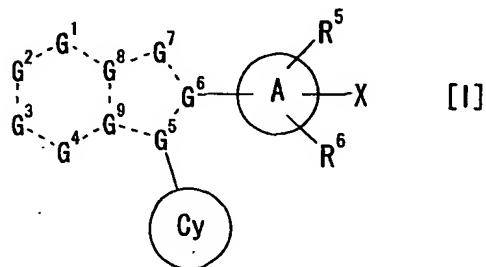
上記結果から明らかな様に、本発明の化合物はHCVポリメラーゼに対し高い阻害活性を示す。

よって、これら化合物は、HCVポリメラーゼ阻害活性により抗HCV作用を示すC型肝炎の予防若しくは治療に有効な薬剤となり得る。また、インターフェロン等の他の抗HCV剤及び／又は他の抗炎症剤等との併用によりC型肝炎の予防若しくは治療により有効な薬剤となり得る。また、HCVポリメラーゼに特異的な高い阻害活性を有することは、人体に対し安全な副作用の少ない薬剤となり得ることを示す。

本出願は、日本で出願された特願2001-193786及び特願2001-351537を基礎としており、それらの内容は本明細書に包含されるものである。

## 請求の範囲

1. 下記一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る C 型肝炎治療剤。



[式中、破線は単結合又は二重結合であり、

$G^1$  は、 $C(-R^1)$  又は窒素原子であり、

$G^2$  は、 $C(-R^2)$  又は窒素原子であり、

$G^3$  は、 $C(-R^3)$  又は窒素原子であり、

$G^4$  は、 $C(-R^4)$  又は窒素原子であり、

$G^5$ 、 $G^6$ 、 $G^8$  及び  $G^9$  は、それぞれ独立して、炭素原子又は窒素原子であり、

$G^7$  は、 $C(-R^7)$ 、酸素原子、硫黄原子、又は  $R^8$  で置換されてもよい窒素原子であり、

ここで、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) C1-6 アルカノイル基、

(3) カルボキシ基、

(4) シアノ基、

(5) ニトロ基、

(6) 下記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい C1-6 アルキル基、

グループ A ; ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、アミノ基、C1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシC1-6 アルコキシ基、C1-6 アルコキシカルボニル基及びC1-6 アルキルアミノ基。

(7)  $-COOR^{a1}$ 、

ここで  $R^{a1}$  は、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、下記



グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基、又はグルクロン酸残基を意味する。

グループB；ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで $R^{b1}$ 及び $R^{b2}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基を意味し、 $r$ は0又は1乃至6の整数である。

(8)  $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで $R^{a2}$ 及び $R^{a3}$ は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(9)  $-C(=NR^{a4})NH_2$ 、

ここで $R^{a4}$ は、水素原子又は水酸基を意味する。

(10)  $-NHR^{a5}$ 、

ここで $R^{a5}$ は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル基を意味する。

(11)  $-OR^{a6}$ 、

ここで $R^{a6}$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(12)  $-SO_2R^{a7}$ 、

ここで $R^{a7}$ は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。

(13)  $-P(=O)(OR^{a31})_2$

ここで $R^{a31}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

又は、

(14) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を

含んでなるヘテロ環基であり、

$R^7$  及び  $R^8$  は、水素原子又は置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）であり、

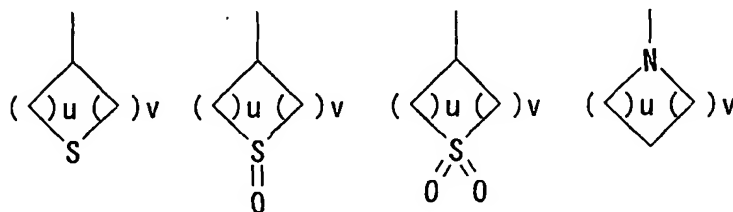
環 C y は、

(1) 下記グループ C から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル基、

グループ C: 水酸基、ハロゲン原子、C1-6 アルキル基及び C1-6 アルコキシ基。

(2) 前記グループ C から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルケニル基又は、

(3)



（式中、u 及び v は、それぞれ独立して 1 乃至 3 の整数を表す。）であり、

環 A は、

(1) C6-14 アリール基、

(2) C3-8 シクロアルキル基、

(3) C3-8 シクロアルケニル基、又は、

(4) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

$R^5$  及び  $R^6$  は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

(3) 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、又は、

(4)  $-OR^{a8}$

ここで  $R^{a8}$  は、水素原子、C1-6 アルキル基又は C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

であり、

Xは、

- (1) 水素原子、
- (2) ハロゲン原子、
- (3) シアノ基、
- (4) ニトロ基、
- (5) アミノ基、C1-6 アルカノイルアミノ基、
- (6) C1-6 アルキルスルホニル基、
- (7) 置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、
- (8) 前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC2-6 アルケニル基、
- (9)  $-COOR^{a9}$ 、

ここで $R^{a9}$ は、水素原子又はC1-6 アルキル基を意味する。

- (10)  $-CONH-(CH_2)_1-R^{a10}$ 、

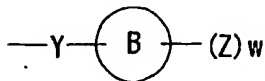
ここで $R^{a10}$ は、置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、C1-6 アルコキシカルボニル基又はC1-6 アルカノイルアミノ基であり、1は、0又は1乃至6の整数を意味する。

- (11)  $-OR^{a11}$ 、

ここで $R^{a11}$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

又は、

- (12)



{式中、環Bは、

- (1') C6-14 アリール基、
  - (2') C3-8 シクロアルキル基、又は、
  - (3') ヘテロ環基（前記定義の通り。）であり、
- Zは、それぞれ独立して、

- (1') 下記グループDから選ばれる基、  
(2') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C  
6-14 アリール基、  
(3') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C  
3-8 シクロアルキル基、  
(4') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C  
6-14 アリール C1-6 アルキル基、  
(5') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテ  
ロ環基、  
ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子又は硫黄原子から選ばれる 1 乃至  
4 個のヘテロ原子を含む。

又は、

- (6') 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテ  
ロ環 C1-6 アルキル基、  
ここで当該ヘテロ環 C1-6 アルキル基は、前記定義の通りの「グループDから  
選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換された C1-6  
アルキル基を意味する。

であり、

グループD：

- (a) 水素原子、  
(b) ハロゲン原子、  
(c) シアノ基、  
(d) ニトロ基、  
(e) 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、  
(f)  $-(CH_2)_t-COR^{a18}$ 、

以下、 $t$  は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

ここで  $R^{a18}$  は、

- (1'') 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、  
(2'') 前記グループBから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい

C6-14 アリール基、又は、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

であり、

(g)  $-(CH_2)_4-COOR^{a19}$ 、

ここで $R^{a19}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基C1-6アルキル基を意味する。

(h)  $-(CH_2)_4-CONR^{a27}R^{a28}$ 、

ここで $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6アルキル基を意味する。

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、

(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基、

(9'')水酸基、又は、

(10'')C1-6アルコキシ基であり、

(i)  $-(CH_2)_t-C(=NR^{a33})NH_2$ 、

ここで $R^{a33}$ は、水素原子、C1-6アルキル基、水酸基又はC1-6アルコキシ基を意味する。

(j)  $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、

ここで $R^{a20}$ は、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')置換されてもよいC2-6アルケニル基（前記定義の通り。）、

(4'')前記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC2-6アルキニル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(7'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

(8'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

(9'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基、又は、

(10'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキルC1-6アルキル基であり、

(k)  $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$ 、

ここで $R^{a21}$ は、アミノ基、C1-6アルキルアミノ基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、pは0又は1乃至6の整数を意味する。

(l)  $-(CH_2)_t-NR^{a22}R^{a23}$ 、

ここで $R^{a22}$ 及び $R^{a23}$ は、それぞれ独立して、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリールC1-6アルキル基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、又は、

(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

(m)  $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ 、

ここで $R^{a29}$ は、水素原子、C1-6アルキル基又はC1-6アルカノイル基を意味し、

$R^{a24}$ は、

(1'')アミノ基、

(2'')C1-6アルキルアミノ基、

(3'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

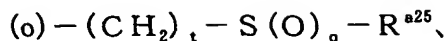
(4'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基、

(5'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、又は、

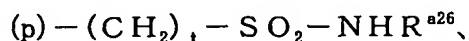
(6'')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、を意味する。

(n)  $-(CH_2)_t-NR^{a29}SO_2-R^{a25}$ 、

ここで $R^{a29}$ は前記定義の通りであり、 $R^{a25}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで $R^{a25}$ は前記定義の通りであり、 $q$ は0、1又は2である。



ここで $R^{a26}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

及び、

(q)酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

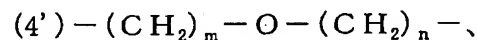
$w$ は、1乃至3の整数であり、

$Y$ は、

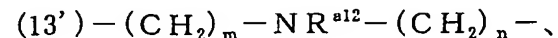
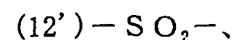
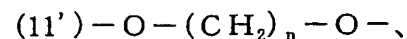
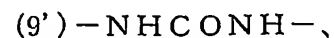
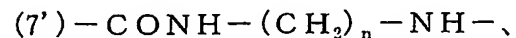
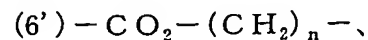
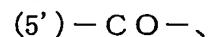
(1')単結合、

(2')C1-6アルキレン、

(3')C2-6アルケニレン、



以下、 $m$ 及び $n$ は、それぞれ独立して、0又は1乃至6の整数を意味する。



ここで $R^{a12}$ は、

(1'')水素原子、

(2'')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、



(3'') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C6-14 アリールC1-6 アルキル基、

(4'') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい  
C6-14 アリール基、

(5'')  $-COR^{b5}$ 、

ここで $R^{b5}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

(6'')  $-COOR^{b5}$  ( $R^{b5}$ は前記定義の通り。)、又は、

(7'')  $-SO_2R^{b5}$  ( $R^{b5}$ は前記定義の通り。)、

(14')  $-NR^{a12}CO-$  ( $R^{a12}$ は前記の定義と同じ。)、

(15')  $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、

ここで $R^{a13}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

(16')  $-CONH-CHR^{a14}-$ 、

ここで $R^{a14}$ は、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基を意味する。

(17')  $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 、

ここで $R^{a15}$ 及び $R^{a16}$ は、それぞれ独立して、

(1'') 水素原子、

(2'') カルボキシ基、

(3'') C1-6 アルキル基、

(4'')  $-OR^{b6}$ 、

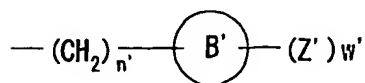
ここで $R^{b6}$ は、C1-6 アルキル基又はC6-14 アリールC1-6 アルキル基を意味する。

又は、

(5'')  $-NHR^{b7}$

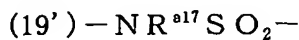
ここで $R^{b7}$ は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリアルC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、  
更に $R^{a15}$ は、  
(6'')



であってもよく、  
ここで $n'$ 、環 $B'$ 、 $Z'$ 及び $w'$ は、それぞれ上記 $n$ 、環 $B$ 、 $Z$ 及び $w$ と同義であり、それぞれ $n$ 、環 $B$ 、 $Z$ 及び $w$ と同一若しくは異なってもよい。

(18')- $(CH_2)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-(R^{a12}$ 及び $R^{a15}$ は、それぞれ前記定義の通り。)、



ここで $R^{a17}$ は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

(20')- $S(O)_e-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-(e$ は0、1又は2であり、 $R^{a15}$ 及び $R^{a16}$ は、それぞれ前記定義の通り。)、又は、

(21')- $(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-(R^{a15}$ 及び $R^{a16}$ は、それぞれ前記定義の通り。)

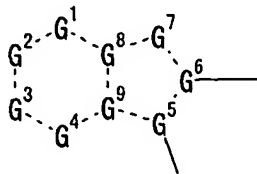
である。}である。]

2.  $G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、 $G^4$ 、 $G^5$ 、 $G^6$ 、 $G^7$ 、 $G^8$ 及び $G^9$ のうち1乃至4個が窒素原子である請求項1記載のC型肝炎治療剤。

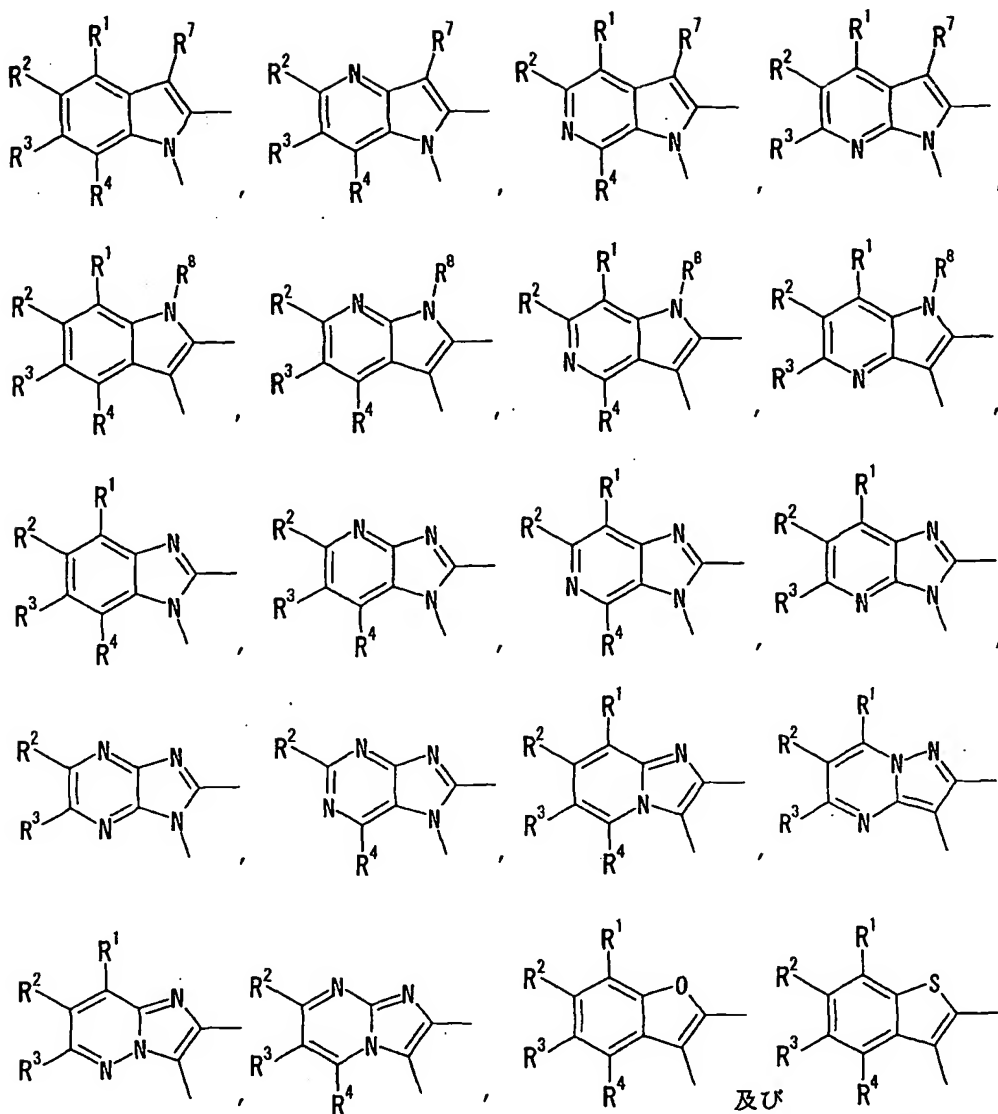
3.  $G^2$ が $C(-R^2)$ であり、 $G^6$ が炭素原子である請求項2記載のC型肝炎治療剤。

4.  $G^5$ が窒素原子である請求項2又は請求項3記載のC型肝炎治療剤。

5. 一般式[I]の

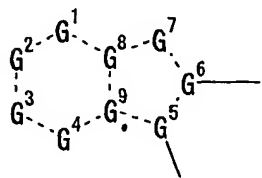


部位が、

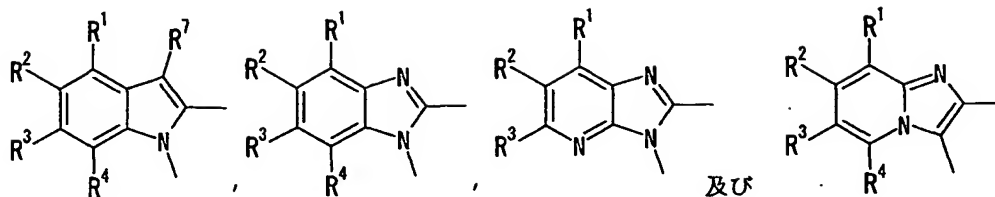


からなる群より選ばれる縮合環である請求項 1 記載の C 型肝炎治療剤。

6. 一般式 [I] の

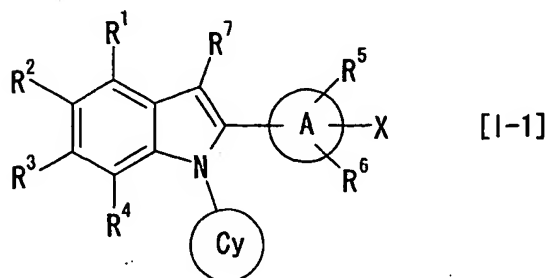


部位が、



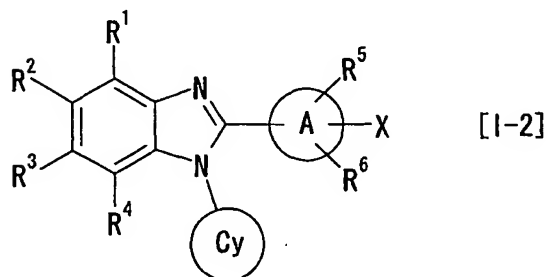
からなる群より選ばれる縮合環である請求項 5 記載の C 型肝炎治療剤。

7. 下記一般式 [I-1] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



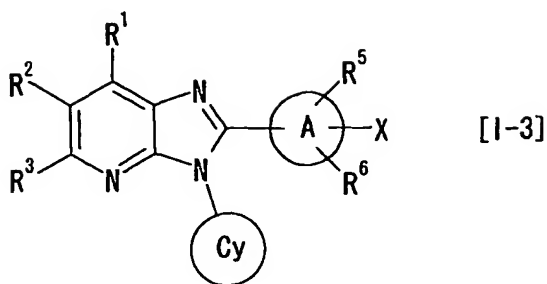
(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

8. 下記一般式 [I-2] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



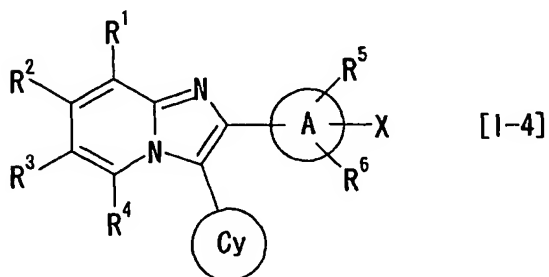
(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

9. 下記一般式 [I-3] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



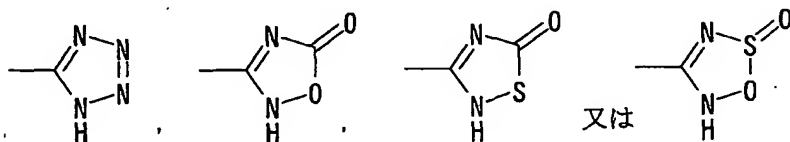
(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

10. 下記一般式 [I-4] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含んで成る請求項 6 記載の C 型肝炎治療剤。



(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)

11.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシ基、 $-COOR^{a1}$ 、 $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、 $-SO_2R^{a7}$  ( $R^{a1}$ 、 $R^{a2}$ 、 $R^{a3}$  及び  $R^{a7}$  は請求項 1 記載の通りである。)、



である請求項 1 乃至 10 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

12.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシ基、 $-COOR^{a1}$ 、 $-CONR^{a2}R^{a3}$  又は  $-SO_2R^{a7}$  ( $R^{a1}$ 、 $R^{a2}$ 、 $R^{a3}$  及び  $R^{a7}$  は請求項 1 記載の通りである。) である請求項 11 に記載の C 型肝炎治療剤。

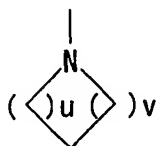
13.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが  $-COOR^{a1}$  であり、 $R^{a1}$  がグルクロン酸残基である請求項 1 乃至 10 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

14.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、酸素原子、窒素原子及

び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である請求項 1 乃至 10 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

15. 環 Cy が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、テトラヒドロチオピラニル基又はピペリジノ基である請求項 1 乃至 14 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

16. 環 Cy が、



(式中、各記号は請求項 1 記載の通りである。)である請求項 1 乃至 14 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

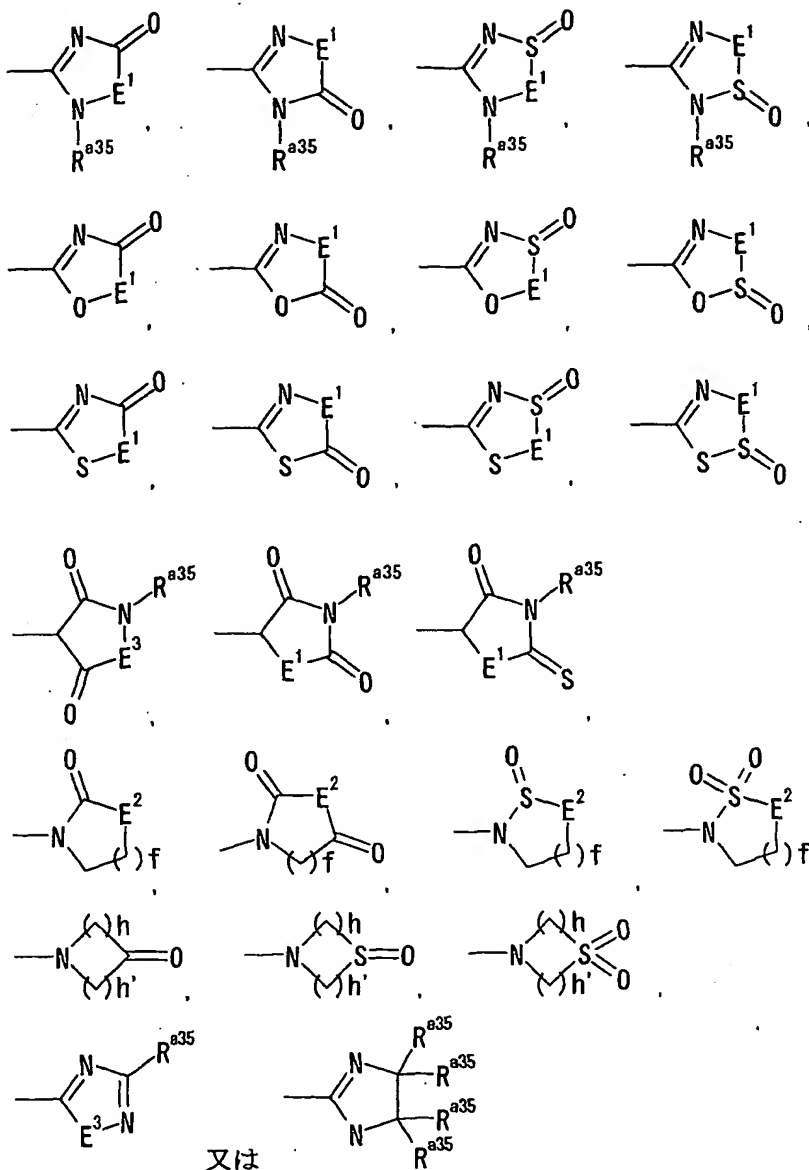
17. 環 A が、C6-14 アリール基である請求項 1 乃至 16 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

18. グループ A によって置換されてもよい置換基のうち少なくとも何れか 1 つが、C1-6 アルコキシ C1-6 アルコキシ基で置換された置換基である請求項 1 乃至 17 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

19. Y が、 $-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  (各記号は、請求項 1 記載の通りである。)である請求項 1 乃至 18 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

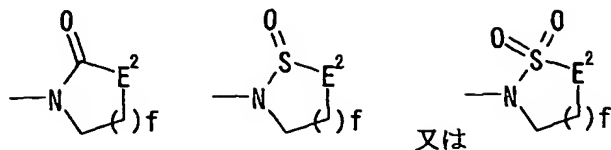
20. Z の少なくとも一つが、グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環 C1-6 アルキル基である請求項 1 乃至 19 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

21. Z の少なくとも一つが、グループ D から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



(式中、 $E^1$ は酸素原子、硫黄原子又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^2$ は酸素原子、 $CH_2$ 又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^3$ は酸素原子又は硫黄原子であり、ここで $R^{a35}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基であり、 $f$ は1乃至3の整数であり、 $h$ 及び $h'$ はそれぞれ同一若しくは異なって1乃至3の整数である。)である請求項1乃至19のいずれかに記載のC型肝炎治療剤。

22. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



(式中、各記号は請求項 2 1 記載の通りである。) である請求項 2 1 に記載の C 型肝炎治療剤。

2 3. グループ D の少なくとも一つが  $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$  (各記号は、請求項 1 記載の通りである。) であり、 $R^{a27}$  及び  $R^{a28}$  の少なくとも何れか一方が、C1-6 アルコキシ基である請求項 1 乃至 1 9 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

2 4. グループ D の少なくとも一つが  $-(CH_2)_t-C(=NR^{a33})NH_2$  (各記号は、請求項 1 記載の通りである。) であり、 $R^{a33}$  が水酸基又は C1-6 アルコキシ基である請求項 1 乃至 1 9 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

2 5. グループ D の少なくとも一つが  $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$  (各記号は、請求項 1 記載の通りである。) であり、 $R^{a21}$  がアミノ基である請求項 1 乃至 1 9 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

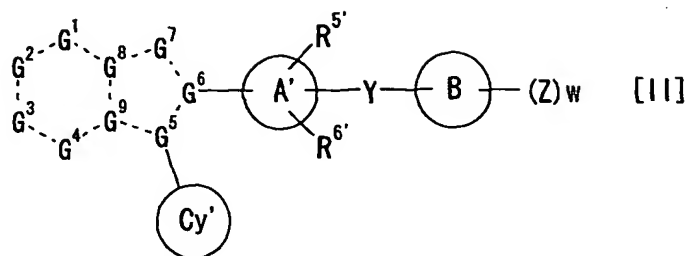
2 6. グループ D の少なくとも一つが  $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$  (各記号は、請求項 1 記載の通りである。) であり、 $R^{a24}$  がアミノ基又は C1-6 アルキルアミノ基である請求項 1 乃至 1 9 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

2 7. グループ D の少なくとも一つが  $-(CH_2)_t-NR^{a22}R^{a23}$  (各記号は、請求項 1 記載の通りである。) であり、 $R^{a22}$  及び  $R^{a23}$  の少なくとも何れか一方が、グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基である請求項 1 乃至 1 9 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

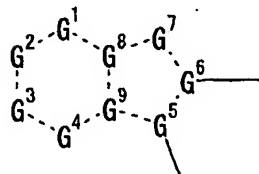
2 8. グループ D の少なくとも一つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である請求項 1 乃至 1 9 のいずれかに記載の C 型肝炎治療剤。

2 9. 下記一般式 [II] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

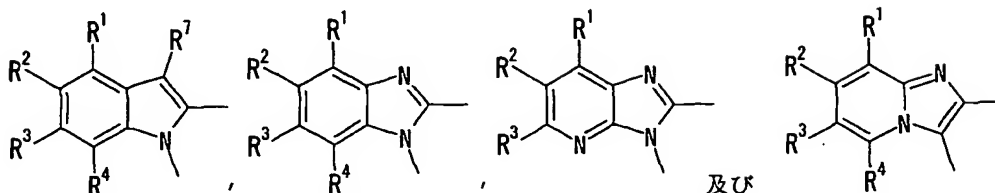




[式中、



部位は、



からなる群より選ばれる縮合環であり、

ここで、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、

- (1) 水素原子、
- (2) C1-6 アルカノイル基、
- (3) カルボキシル基、
- (4) シアノ基、
- (5) ニトロ基、

(6) 下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよいC1-6アルキル基、

グループA；ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基、アミノ基、C1-6アルコキシ基、C1-6アルコキシC1-6アルコキシ基、C1-6アルコキシカルボニル基及びC1-6アルキルアミノ基。

- (7)  $-\text{COOR}^{\text{a1}}$ 、

ここで $R^{\text{a1}}$ は、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、下記

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基、又はグルクロン酸残基を意味する。

グループB；ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-6アルキル基、ハロゲン化C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基、 $-(CH_2)_r-COOR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-CONR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}R^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NR^{b1}-COR^{b2}$ 、 $-(CH_2)_r-NHSO_2R^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-OR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SR^{b1}$ 、 $-(CH_2)_r-SO_2R^{b1}$ 及び $-(CH_2)_r-SO_2NR^{b1}R^{b2}$ 。

ここで $R^{b1}$ 及び $R^{b2}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基を意味し、 $r$ は0又は1乃至6の整数である。

(8)  $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、

ここで $R^{a2}$ 及び $R^{a3}$ は、それぞれ独立して、水素原子、C1-6アルコキシ基又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(9)  $-C(=NR^{a4})NH_2$ 、

ここで $R^{a4}$ は、水素原子又は水酸基を意味する。

(10)  $-NHR^{a5}$ 、

ここで $R^{a5}$ は、水素原子、C1-6アルカノイル基又はC1-6アルキルスルホニル基を意味する。

(11)  $-OR^{a6}$ 、

ここで $R^{a6}$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）を意味する。

(12)  $-SO_2R^{a7}$ 、

ここで $R^{a7}$ は、水酸基、アミノ基、C1-6アルキル基又はC1-6アルキルアミノ基を意味する。

(13)  $-P(=O)(OR^{a31})_2$

ここで $R^{a31}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14アリアルC1-6アルキル基を意味する。

又は、

(14) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を

含んでなるヘテロ環基であり、

$R^7$ は、水素原子又は置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）であり、

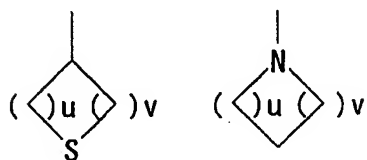
環C $y'$ は、

(1) 下記グループCから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC3-8シクロアルキル基

グループC; 水酸基、ハロゲン原子、C1-6アルキル基及びC1-6アルコキシ基。

又は、

(2)



(式中、 $u$ 及び $v$ は、それぞれ独立して1乃至3の整数を表す。)であり、

環A'は、

(1) フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、シクロヘキシル基、シクロヘキセニル基、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれる基であり、

$R^{6'}$ 及び $R^{6''}$ は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

(3) 置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、又は、

(4) 水酸基

であり、

環Bは、

(1) C6-14アリール基、

(2) C3-8シクロアルキル基、又は、

(3) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり、

Zは、それぞれ独立して、

- (1) 下記グループDから選ばれる基、
- (2) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、
- (3) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル基、
- (4) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、又は、
- (5) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含む。

又は、

- (6) 下記グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環 C1-6 アルキル基、

ここで当該ヘテロ環 C1-6 アルキル基は、前記定義の通りの「グループDから選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換された C1-6 アルキル基を意味する。

であり、

グループD：

- (a) 水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c) シアノ基、
- (d) ニトロ基、
- (e) 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、
- (f)  $-(CH_2)_t-COR^{*18}$ 、

以下、t は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。

ここで  $R^{*18}$  は、

- (1') 置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、

(2')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、又は、

(3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

ここで当該ヘテロ環基は酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を含む。

であり、

(g)  $-(CH_2)_t-COOR^{a19}$ 、

ここで $R^{a19}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）又は前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基C1-6アルキル基を意味する。

(h)  $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ 、

ここで $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ は、それぞれ独立して、

(1')水素原子、

(2')置換されてもよいC1-6アルキル基（前記定義の通り。）、

(3')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリール基、

(4')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 6-14 アリールC1-6アルキル基、

(5')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

(6')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基、

ここで当該ヘテロ環C1-6アルキル基は、前記定義の通りの「前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基」で置換されたC1-6アルキル基を意味する。

(7')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC 3-8 シクロアルキル基、

(8')前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC

3-8 シクロアルキル C1-6 アルキル基、

(9') 水酸基、又は、

(10') C1-6 アルコキシ基であり、

(i)  $-(CH_2)_t-C(=NR^{a33})NH_2$ 、

ここで  $R^{a33}$  は、水素原子、C1-6 アルキル基、水酸基又は C1-6 アルコキシ基を意味する。

(j)  $-(CH_2)_t-OR^{a20}$ 、

ここで  $R^{a20}$  は、

(1') 水素原子、

(2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3') 置換されてもよい C2-6 アルケニル基 (前記定義の通り。)、

(4') 前記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい C2-6 アルキニル基、

(5') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、

(6') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、

(7') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、

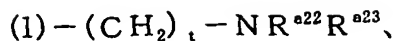
(8') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環 C1-6 アルキル基、

(9') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル基、又は、

(10') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C3-8 シクロアルキル C1-6 アルキル基であり、

(k)  $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$ 、

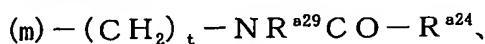
ここで  $R^{a21}$  は、アミノ基、C1-6 アルキルアミノ基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、 $p$  は 0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。



ここで $R^{a22}$ 及び $R^{a23}$ は、それぞれ独立して、

- (1') 水素原子、
- (2') 置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、
- (3') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基、
- (4') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリールC1-6 アルキル基、
- (5') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6 アルキル基、又は、

(6') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



ここで $R^{a29}$ は、水素原子、C1-6 アルキル基又はC1-6 アルカノイル基を意味し、

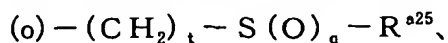
$R^{a24}$ は、

- (1') アミノ基、
- (2') C1-6 アルキルアミノ基、
- (3') 置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、
- (4') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基、
- (5') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基、又は、
- (6') 前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6 アルキル基、を意味する。

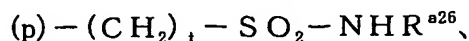


ここで $R^{a29}$ は前記定義の通りであり、 $R^{a25}$ は、水素原子、置換されてもよいC1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいC6-14 アリール基又は前記グループBから選ばれる

1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。



ここで  $R^{a25}$  は前記定義の通りであり、 $q$  は 0、1 又は 2 である。



ここで  $R^{a26}$  は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基（前記定義の通り。）、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基を意味する。

及び、

(q) 酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基であり

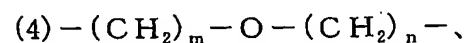
$w$  は、1 乃至 3 の整数であり、

$Y$  は、

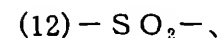
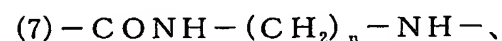
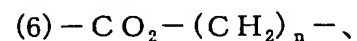
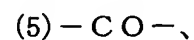
(1) 単結合、

(2) C1-6 アルキレン、

(3) C2-6 アルケニレン、



以下、 $m$  及び  $n$  は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 6 の整数を意味する。



ここで  $R^{a12}$  は、

(1') 水素原子、



(2') 置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、

(3') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基、

(4') 前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基、

(5')  $-COR^{b5}$ 、

ここで  $R^{b5}$  は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(6')  $-COOR^{b5}$  ( $R^{b5}$  は前記定義の通り。)、又は、

(7')  $-SO_2R^{b5}$  ( $R^{b5}$  は前記定義の通り。)、

(14)  $-NR^{a12}CO-$  ( $R^{a12}$  は前記の定義と同じ。)、

(15)  $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、

ここで  $R^{a13}$  は、水素原子、置換されてもよい C1-6 アルキル基 (前記定義の通り。)、又は前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

(16)  $-CONH-CHR^{a14}-$ 、

ここで  $R^{a14}$  は、前記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい C6-14 アリール基を意味する。

(17)  $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$ 、

ここで  $R^{a15}$  及び  $R^{a16}$  は、それぞれ独立して、

(1') 水素原子、

(2') カルボキシ基、

(3') C1-6 アルキル基、

(4')  $-OR^{b6}$ 、

ここで  $R^{b6}$  は、C1-6 アルキル基又は C6-14 アリール C1-6 アルキル基を意味する。

又は、

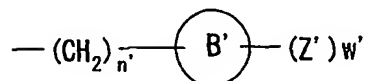
(5')-NHR<sup>b7</sup>

ここでR<sup>b7</sup>は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6アルカノイル基又はC6-14アリアルC1-6アルキルオキシカルボニル基を意味する。

であり、

更にR<sup>a15</sup>は、

(6')



であってもよく、

ここでn'、環B'、Z'及びw'は、それぞれ上記n、環B、Z及びwと同義であり、それぞれn、環B、Z及びwと同一若しくは異なってもよい。

(18)-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sup>a12</sup>-CHR<sup>a15</sup>-(R<sup>a12</sup>及びR<sup>a15</sup>は、それぞれ前記定義の通り。)、

(19)-NR<sup>a17</sup>SO<sub>2</sub>-、

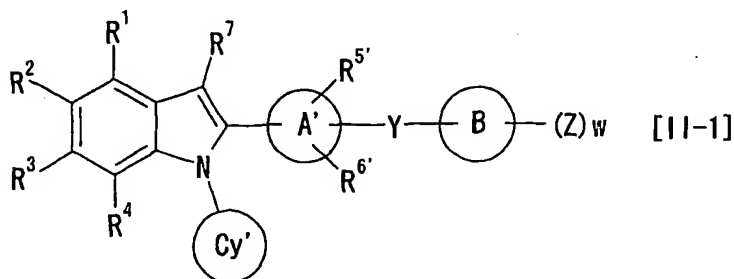
ここでR<sup>a17</sup>は、水素原子又はC1-6アルキル基を意味する。

(20)-S(O)<sub>e</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-CR<sup>a15</sup>R<sup>a16</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(eは0、1又は2であり、R<sup>a15</sup>及びR<sup>a16</sup>は、それぞれ前記定義の通り。)、又は、

(21)-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-CR<sup>a15</sup>R<sup>a16</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(R<sup>a15</sup>及びR<sup>a16</sup>は、それぞれ前記定義の通り。)

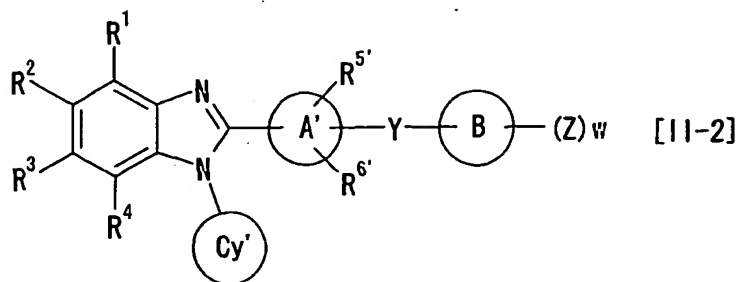
である。]

30. 下記一般式[II-1]で表される請求項29記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



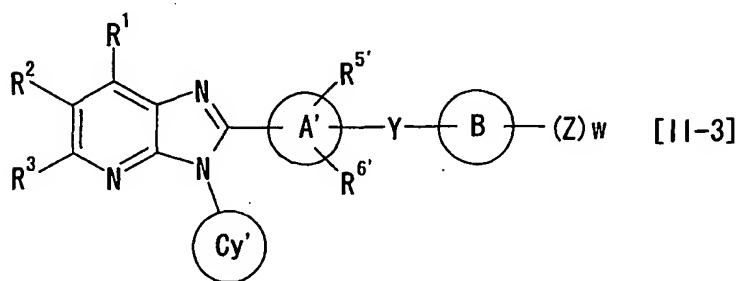
(式中、各記号は請求項29記載の通りである。)

31. 下記一般式 [II-2] で表される請求項 29 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



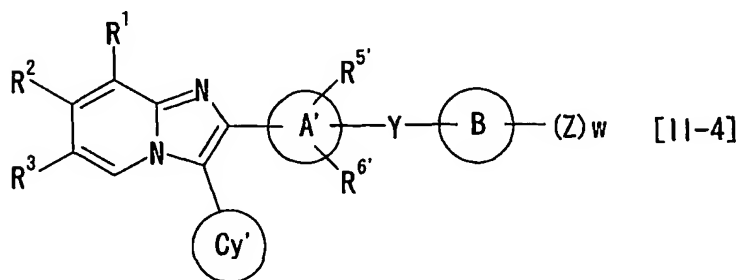
(式中、各記号は請求項 29 記載の通りである。)

32. 下記一般式 [II-3] で表される請求項 29 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は請求項 29 記載の通りである。)

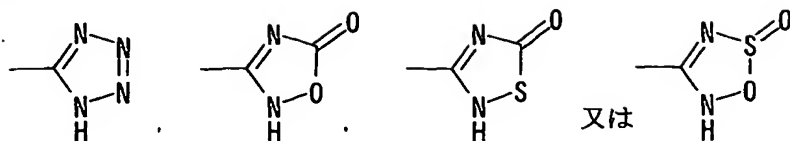
33. 下記一般式 [II-4] で表される請求項 29 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。



(式中、各記号は請求項 29 記載の通りである。)

34.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシル基、 $-COOR^{a1}$ 、 $-CONR^{a2}R^{a3}$ 、 $-SO_2R^{a7}$  ( $R^{a1}$ 、 $R^{a2}$ 、 $R^{a3}$  及び  $R^{a7}$  は請求項 29 記

載の通りである。)、



である請求項 29 乃至 33 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

35.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシ基、 $-COOR^{a1}$  又は  $-SO_2R^{a7}$  (ここで  $R^{a1}$  及び  $R^{a7}$  は請求項 29 記載の通り。) である請求項 34 に記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

36.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、カルボキシ基又は  $-COOR^{a1}$  (ここで  $R^{a1}$  は請求項 29 記載の通り。) である請求項 35 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

37.  $R^2$  がカルボキシ基であり、 $R^1$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  が水素原子である請求項 36 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

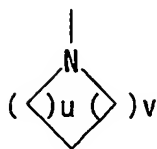
38.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが  $-COOR^{a1}$  であり、 $R^{a1}$  がグルクロン酸残基である請求項 29 乃至 33 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

39.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  のうち少なくとも 1 つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である請求項 29 乃至 33 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

40. 環  $Cy'$  が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基又はテトラヒドロチオピラニル基である請求項 29 乃至 39 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

41. 環  $Cy'$  が、シクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基である請求項 40 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

42. 環  $Cy'$  が、



(式中、各記号は請求項 2 9 記載の通りである。)である請求項 2 9 乃至 3 9 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

4 3. 環 A' が、フェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基又はピリダジニル基である請求項 2 9 乃至 4 2 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

4 4. 環 A' が、フェニル基又はピリジル基である請求項 4 3 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

4 5. 環 A' が、フェニル基である請求項 4 4 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

4 6. グループ A によって置換されてもよい置換基のうち少なくとも何れか 1 つが、C1-6 アルコキシ C1-6 アルコキシ基で置換された置換基である請求項 2 9 乃至 4 5 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

4 7. Y が、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$ 、 $-NHCO_2-$ 、 $-CONH-CH$   
 $R^{a14}-$ 、 $-(CH_2)_m-NR^{a12}-(CH_2)_n-$ 、 $-CONR^{a13}-(CH_2)_n-$ 、 $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  又は  $-(CH_2)_n-NR^{a12}-CHR^{a15}-$  (ここで各記号は請求項 2 9 記載の通り。)である請求項 2 9 乃至 4 6 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

4 8. Y が、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$  又は  $-O-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  (ここで各記号は請求項 2 9 記載の通り。)である請求項 4 7 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

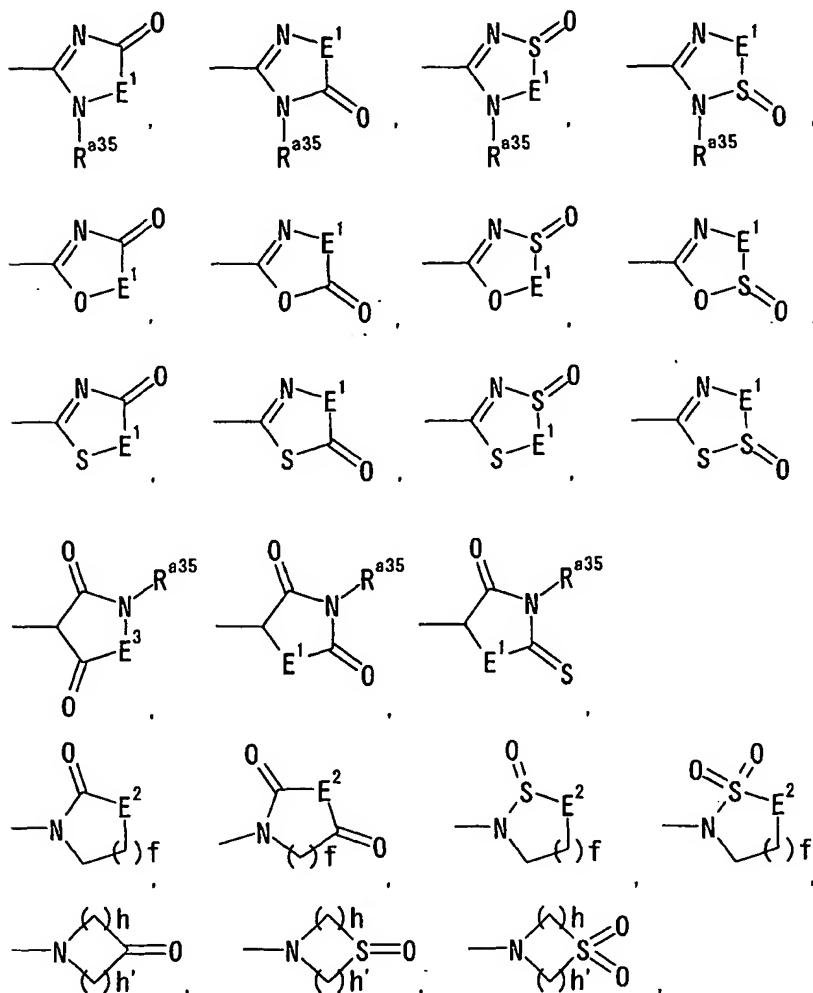
4 9. Y が、 $-(CH_2)_m-O-(CH_2)_n-$  (ここで各記号は請求項 2 9 記載の通り。)である請求項 4 8 記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

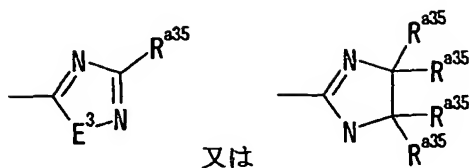
5 0. Y が、 $-(CH_2)_m-CR^{a15}R^{a16}-(CH_2)_n-$  (各記号は、請求項 2 9 記載の通りである。)である請求項 2 9 乃至 4 6 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

51.  $R^2$ がカルボキシル基であり、 $R^1$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ が水素原子であり、環C $y'$ がシクロペンチル基、シクロヘキシル基又はシクロヘプチル基であり、環A'がフェニル基である請求項29乃至50のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

52. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環C1-6アルキル基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

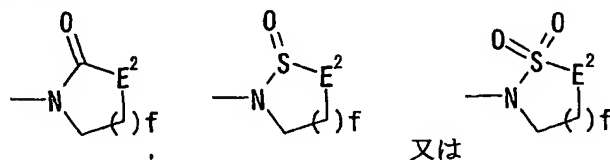
53. Zの少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、





(式中、 $E^1$ は酸素原子、硫黄原子又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^2$ は酸素原子、 $CH_2$ 又は $N(-R^{a35})$ であり、 $E^3$ は酸素原子又は硫黄原子であり、ここで $R^{a35}$ は、それぞれ独立して、水素原子又はC1-6アルキル基であり、 $f$ は1乃至3の整数であり、 $h$ 及び $h'$ はそれぞれ同一若しくは異なって1乃至3の整数である。)である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

54.  $Z$ の少なくとも一つが、グループDから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよいヘテロ環基であり、



(式中、各記号は請求項53記載の通りである。)である請求項53に記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

55. グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-CONR^{a27}R^{a28}$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 $R^{a27}$ 及び $R^{a28}$ の少なくとも何れか一方が、C1-6アルコキシ基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

56. グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-C(=NR^{a33})NH_2$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 $R^{a33}$ が、水酸基又はC1-6アルコキシ基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

57. グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-O-(CH_2)_p-COR^{a21}$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 $R^{a21}$ が、アミノ基である請求項29乃至51のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

58. グループDの少なくとも一つが $-(CH_2)_t-NR^{a29}CO-R^{a24}$ (各記号は、請求項29記載の通りである。)であり、 $R^{a24}$ が、アミノ基又はC1-6アルキ

ルアミノ基である請求項 29 乃至 51 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

59. グループ D の少なくとも一つが  $-(CH_2)_t-NR^{a22}R^{a23}$  (各記号は、請求項 29 記載の通りである。) であり、 $R^{a22}$  及び  $R^{a23}$  の少なくとも何れか一方が、アミノ基又は C1-6 アルキルアミノ基である請求項 29 乃至 51 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

60. グループ D の少なくとも一つが、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を含んでなるヘテロ環基である請求項 29 乃至 51 のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

61. 2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-[4-(3-ブロモフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ブロモ-5-メトキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[(E)-2-フェニルビニル]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、



1-シクロヘキシル-2-{4-[(E)-2-フェニルビニル]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-シアノ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミドオキシム、

1-シクロヘキシル-2-{4-[[4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル]メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロヘキシル-2-{4-[[4-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-5-チアゾリル]メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[ビス(3-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-(3-クロロフェニル)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-{4-[3-(3-クロロフェニル)フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-アセトキシフェニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシ

ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェニルオキシ)フェニル]  
ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピリジルメトキシ)フェニルオ  
キシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルエステル、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピリジルメトキシ)フェニルオ  
キシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾ  
ール、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾ  
ール-5-カルボン酸エチルエステル、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N,N-ジメチ  
ルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N-メトキシ-  
N-メチルベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-(1-ヒド  
ロキシ-1-メチルエチル)ベンゾイミダゾール、

5-アセチル-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベ  
ンゾイミダゾール、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-N-(2-ジメ  
チルアミノエチル)ベンゾイミダゾール-5-カルボキサミド 二塩酸塩、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-ニトロベン  
ゾイミダゾール、

5-アミノ-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベン  
ゾイミダゾール 塩酸塩、

5-アセチルアミノ-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペン  
チルベンゾイミダゾール、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-5-メタンスル  
ホニルアミノベンゾイミダゾール、

5-スルファモイル-2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-[4-(4-tert-ブチルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(4-カルボキシベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(4-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(2-クロロ-5-チエニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メトキシベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-ピリジルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロペンチル-2-[4-(4-メチルベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-{4-[(3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル)メトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-イル]カルボニルアミノ酢酸、

2-[4-(2-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-クロロベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(ベンゼンスルホニルアミノ)フェニル]-1-シクロペンチルベ

ンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(3, 5-ジクロロフェニルカルボニルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(4-クロロフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(4-tert-ブチルフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(4-ベンジルオキシフェニル)カルボニルアミノ]フェニル}-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

trans-4-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]シクロヘキサ-1-オール、

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-メトキシシクロヘキサン、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシメチル-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2-[(4-シクロヘキシルフェニル)カルボニルアミノ]-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(3, 5-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(フェニルカルバモイルアミノ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-[4-(ジフェニルメトキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロペンチル-2-(4-フェネチルオキシフェニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

trans-1-[2-(4-ベンジルオキシフェニル)-5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル]-4-tert-ブチルシクロヘキサン、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 5-カルボキシメトキシ-1-シクロペンチルベンゾイミダゾール、

2- (4-ベンジルアミノフェニル) - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (N-ベンゼンスルホニル-N-メチルアミノ) フェニル] - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (N-ベンジル-N-メチルアミノ) フェニル] - 1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- (4-フェネチルフェニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3, 5-ジクロロベンジルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (ジフェニルメトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3, 5-ジ-tert-ブチルベンジルオキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 1- (4-メチルシクロヘキシル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (2-ナフチル) エトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (1-ナフチル) メトキシフェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (ジベンジルアミノ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (2-ビフェニリルメトキシ) フェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (ジベンジルメトキシ) フェニル] ベンゾイ

ミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンゾイルメトキシフェニル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3,3-ジフェニルプロピルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(フェノキシ)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-フェニルプロピルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(2-ベンジルオキシ-5-ピリジル)-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3,4,5-トリメトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-(4,4-ジメチルシクロヘキシル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(1-ナフチル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ベンジルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-ベンジルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-ヒドロキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-ヒドロキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-メトキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-プロポキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(2-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-イソペンチルオキシフェノキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(10, 11-ジヒドロ-5H-ジベンゾ[b, f]アゼピン-5-イル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(4-クロロフェニル)メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(2-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(3-メトキシフェニル)エトキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 1-シクロヘプチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (2-フェネチルオキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3-フェネチルオキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (2, 2-ジフェニルエトキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

c i s-1- [2- (4-ベンジルオキシフェニル) - 5-カルボキシベンゾイミダゾール-1-イル] - 4-フルオロシクロヘキサン、

1-シクロヘキシル-2- [4- (2-フェノキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- [4- (3-フェノキシフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [(2R) - 2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-2-フェニルエトキシ]フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {2-フルオロ-4- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (4-ベンジルオキシフェノキシ) フェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [ビス (4-メチルフェニル) メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [ビス (4-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-6-メトキシ-2- [4- (3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-6-ヒドロキシ-2- [4- (3-フェニルプロポキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、



1-シクロヘキシル-6-メチル-2-[4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(2-ベンジルオキシフェニル)エトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(3-ベンジルオキシフェニル)エトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-カルボキシメチルオキシフェノキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(4-メトキシフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{2-メチル-4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-tert-ブチルフェニル)-5-クロロベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-(3-クロロ-6-フェニルベンジルオキシ)-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(3,5-ジクロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[ビス(4-フルオロフェニル)メトキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-2-クロロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-(4-ベンジルオキシフェノキシ)-2-トリフルオロメチルフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(2-トリフルオロメチルフェニル)ベンジル

オキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[(2R)-2-アミノ-2-フェニルエトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ビフェニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(3-ビフェニルオキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-[(1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル)メトキシ]フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-[(1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル)メトキシ]フェノキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-クロロ-6-(3,4,5-トリメトキシフェニル)ベンジロキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(2-ビフェニル)エトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-(2-ビフェニルメトキシ)フェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[2-(4-ピペリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-ピペリジルメトキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[(2R)-2-アセチルアミノ-2-フェニルエトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(4-メチル-3-ペンテニルオキシ)フェノキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3-メチル-3-ブテニルオキシ)

フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{(2S)-1-ベンジル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メチルチオフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メタンスルホニルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (2-チエニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (3-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (3-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (4-ベンジルオキシフェノキシ) -3-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (2-ブロモ-5-クロロベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- {(1-アセチル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- {(1-アセチル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (2-プロピニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3-ピリジルメトキシ) フェノキシ]

フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- (4-ベンジルオキシ-2-メトキシフェニル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (2-ブロモ-5-メトキシベンジルオキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- (カルボキシジフェニルメトキシ) フェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ニトロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-アセチルアミノ-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [(2S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-ピロリジニル] メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {2-クロロ-4- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (2-ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-フルオロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-カルボキシ-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-カルバモイル-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (ピペリジノカルボニルメトキシ) フ

エノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{(2S)-1-ベンゼンスルホニル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{(2S)-1-ベンゾイル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-カルバモイルフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (ジメチルカルバモイルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (ピペリジノカルボニルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- {(1-メタンスルホニル-4-ピペリジル) メトキシ] フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{2-メチル-5- (4-クロロフェニル) -4-オキサゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- (3-クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- (4-クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-フルオロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{(2S)-1- (4-ニトロフェニル) -2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{(2S)-1-フェニル-2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{(2S)-1- (4-アセチルアミノフェニル) -2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{5- (4-クロロフェニル) -2-メチル-4-チアゾリル} メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -3-ニトロベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-テトラヒドロピラニルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- {(1-メチル-4-ピペリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- (4-tert-ブチルベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- (2-クロロベンジルオキシ) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (3-ピリジル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3- (4-メトキシフェニル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-メタンスルホニルフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{4- (4-クロロフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル} メトキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [1- (4-クロロベンジル) -3-ピペリジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-{(2-メチル-4-チアゾリル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-{(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-(3, 5-ジクロロフェニル) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[1-(4-クロロベンジル) -4-ピペリジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-(4-クロロベンジルオキシ) ピペリジノ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[4-カルバモイル-2-(4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[4-(4-クロロベンジルオキシ) ピペリジノ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[3-{(2-クロロ-4-ピリジル) メトキシ} フェノキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[{(2S) -1-(4-ジメチルカルバモイルフェニル) -2-ピロリジニル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル) -5-エトキシカルボニルベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2-{4-[4-(4-ジメチルカルバモイルフェニル) -2-メチル-5-チアゾリル] メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル) -5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [{4- (4-クロロフェニル) - 2-メチル- 5-ピリミジニル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-クロロフェニル) - 3-ピリジル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [{3- (4-クロロフェニル) - 2-ピリジル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸、

2- {4- [2- (3-クロロフェニル) - 4-メチルアミノ- 1, 3, 5-トリアジン- 6-イルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 トリフルオロ酢酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 4- (5-テトラゾリル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸、

2- [4- (4-ベンジルオキシ- 6-ピリミジニルオキシ) フェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル- 2- {4- [4- (4-ピリジルメトキシ) - 6-ピリミジニルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸、

2- {4- [4- (3-クロロフェニル) - 6-ピリミジニルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) ピリジン- 2-イルメトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸エチルエステル、

2- [4- (2-ブロモ- 5-tert-ブトキシカルボニルベンジルオキシ) フェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール- 5-カルボン酸メチルエ



ステル、

2- {4- [5-tert-ブトキシカルボニル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸塩酸塩、

2- {4- [3- (tert-ブチルスルファモイル) -6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-スルファモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 トリフルオロ酢酸塩、

2- (4-ベンジルオキシシクロヘキシル) -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [2- (2-ビフェニリルオキシメチル) -5-チエニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [2- (2-ビフェニリルオキシメチル) -5-フリル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) -2-ヒドロキシメチル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [{4- (4-カルボキシフェニル) -2-メ

チル-5-チアゾリル} メトキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2- {2-フルオロ-4- [4-フルオロ-2- (3-フルオロベンゾイル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -3-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-4-カルボン酸、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3-ジメチルカルバモイル-5- (4-ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3-カルボキシ-5- (4-ピリジルメトキシ) フェノキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-4-カルボン酸、

2- {4- [3-カルバモイル-6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-カルボキシフェニル) -3-ピリジル} メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1- (4-テトラヒドロチオピラニル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2- {4- [3-ジメチルカルバモイル-6- (4-トリフルオロメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1-シクロヘキシル-2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-メチルチオフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチルカルバモイルベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ジメチルカルバモイルベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[3-カルバモイル-6-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-メタンスルホニルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(3-ピリジル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2-{4-[3-ジメチルカルバモイル-6-(4-ジメチルカルバモイルフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-(4-テトラヒドロチオピラニル)ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ジメチルスルファモイルベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メタンスルホニルベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルスルファモイルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ジメチルアミノベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メタンスルホニルアミノベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ジエチルカルバモイルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-イソプロピルカルバモイルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ピペリジノカルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (1-ピロリジニル) カルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-ヒドロキシエチル) カルバモイルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジノ) カルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-モルホリノカルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-チオモルホリノカルボニルベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3- (カルボキシメチルカルバモイル) -6- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- {4- (2-カルボキシエチル) フェニル} -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-ヒドロキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [3-クロロ-6- (4-メトキシメチルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (3-カルボキシフェニル) -5-クロロベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルチオベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メチルスルフィニルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-シアノベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [ビス (2-ピリジル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [ビス (4-ジメチルカルバモイルフェニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [ビス (2-チエニル) メトキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸メチルエス

テル、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 ナトリウム塩、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-カルバモイルフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [5-アミノ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [5- (4-クロロフェニル) -2-メトキシベンジルスルフィニル] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (4-クロロフェニル) -2-メトキシベンジルスルホニル] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルチオ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [ビス (4-カルボキシフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [フェニル-3-ピリジルメトキシ] -2-フルオロフェニル} -

1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ベンジルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (シクロヘキシルメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ピリジルメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-ベンジル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5-ジメチルアミノカルボニル-2- (4-ピリジル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {N- (3-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {N- (2-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダ

ゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (シクロヘキシルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-ピリジン-4-イルエチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [(4-フルオロフェニル) (4- (ジメチルアミノカルボニル) フェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [(4-フルオロフェニル) (4-カルボキシフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-オキシピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- ヒドロキシベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (フェニルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-メトキシピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール



ル-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3-ヒドロキシプロピルオキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-ヒドロキシエトキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [4- (2-ブロモ-5-ニトロベンジルオキシ) -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5-ニトロベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4- {5-アミノ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-メチルピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩

2- {4- [5-アセチル-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) メトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-メトキシエトキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {2- (2-メトキシエトキシ) エトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソブチルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-メチルチアゾール-4-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3, 4-ジヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベン

ゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(2-ヒドロキシエチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(4-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (2-アミノチアゾール-4-イル) -2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルスルホニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (4-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (3-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (5-クロロチオフェン-2-イル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2-プロモ-5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジ

ルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2-ブromo-5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5-テトラゾール-5-イルベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-シアノフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-テトラゾール-5-イルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {2- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) エトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキソピペリジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-ヒドロキシアミジノ)

ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (シクロプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (シクロブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (tert-ブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(1-ヒドロキシプロパン-2-イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (メトキシカルバモイル) ベ

ンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(2, 3-ジヒドロキシプロピル) カルバモイル} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-エチル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-メチル-N-プロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2, 6-ジメチルピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (ブチルカルバモイル) - 2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (プロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (エチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(ジメチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(モルホリノカルボニル) アミノ} ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-ウレイドベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(エチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(イソプロピルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3, 4-ジフルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (2, 4-ジフルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3-クロロ-4-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3, 4-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

シルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [4-クロロ-2- (4-クロロフェニル) -5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [4-クロロ-2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルアミノスルホニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロペンチルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジン



－1－イルカルボニル) ベンジルオキシ] －2－フルオロフェニル} －1－シクロペンチルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] －2－フルオロフェニル} －1－シクロペンチルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} －1－シクロペンチルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} －1－シクロペンチルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(4－ヒドロキシピペリジン－1－イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} －1－シクロペンチルベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} －1－(テトラヒドロチオピラン－4－イル) ベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(ピロリジン－1－イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} －1－(テトラヒドロチオピラン－4－イル) ベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] －2－フルオロフェニル} －1－(テトラヒドロチオピラン－4－イル) ベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(2－オキソピロリジン－1－イル) ベンジルオキシ] －2－フルオロフェニル} －1－(テトラヒドロチオピラン－4－イル) ベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2－{4－[2－(4－クロロフェニル) －5－(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] －2－フルオロフェニル} －1－ピペリジノベンゾイミダゾール－5－カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-ピペリジノベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-イミダゾリシ-2-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキソオキサゾリジン-3-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキソイミダゾリジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (2-オキサゾリシ-2-イルアミノ) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [{2- [(ジメチルカルバモイル) メトキシ] メチル} - 4- (4-フルオロフェニル) チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル) チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- [(カルバモイルメトキシ) メチル] チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- (メチルカルバモイル) チアゾール-5-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- {(2-ヒドロキシエチル) カルバモイル} チアゾール-5-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} -

1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) チオフェン-3-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) チオフェン-3-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) - 5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) チオフェン-3-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) - 5-クロロベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシル-5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンゾイミダゾール 塩酸塩、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール、

2- {4- [{N- (4-ジメチルカルバモイル) - N- (4-フルオロフェニル) アミノ} メチル] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {5- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] - 2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {3- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] - 2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [(3-ジメチルカルバモイルフェニル) (4-フルオロフェニル) メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{3- (4-ヒドロキシピペリジル-1-イルカルボニル) フェニル} (4-フルオロフェニル) メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1- {[2- {4- ([4- (4-フルオロフェニル) - 2-メチルチアゾール-5-イル] メトキシ) フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} -  $\beta$ -D-グルクロン酸、

{[2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} -  $\beta$ -D-グルクロン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

3- {[4- (5-アミノスルホニル-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-2-イル) - 3-フルオロフェノキシ] メチル} - 4- (4-クロロフェニル) -N-イソプロピルベンズアミド、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 6- (イソプロピルアミノカルボニル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 4-フルオロ-5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルアミノカルボ

ニル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシル-4-メトキシベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-イソプロピルカルボニル-N-メチルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルカルボニルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[3-{[4-(4-フルオロフェニル)-2-メチルチアゾール-5-イル] メチル} - 4-ヒドロキシフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-4-フルオロ-5-(2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(メチルスルホニルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-メチル-N-(メチルスルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{[3-(4-クロロフェニル)-6-(2-オキソピロリジン-1-イル) ピリジン-2-イル] メチルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(アセチルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-エチルアミノ) ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-プロピルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-エチル-N-(メチルスルホニル)アミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-(メチルスルホニル)-N-プロピルアミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-メチルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-(エチルスルホニル)-N-メチルアミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-エチル-N-(エチルスルホニル)アミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-(エチルカルボニル)-N-メチルアミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-エチル-N-(エチルカルボニル)アミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-イソプロピルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシル

ルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

{[2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ]-2-フルオロフェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル]カルボニル}- $\beta$ -D-グルクロン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルインドール-5-カルボン酸メチルエステル、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシル-1H-インドール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-1-シクロペンチル-1H-インドール-5-カルボン酸、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-カルボン酸エチルエステル、

2-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-シクロヘキシルイミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メトキシベンジルオキシ]フェニル}-3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-6-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルカルバモイル)ベンジルオキシ]フェニル}-3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩、及び

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(ピロリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩からなる群より選ばれる請求項29記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

62. 2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-オキソピペリジノカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-ヒドロキシベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (フェニルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-メトキシピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (3-ヒドロキシプロピルオキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-ヒドロキシエトキシ) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [4- (2-ブromo-5-ニトロベンジルオキシ) -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5-ニトロベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4- {5-アミノ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、



2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(4-メチルピペリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩

2-{4-[5-アセチル-2-(4-クロロフェニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-{(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル)メトキシ}ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-メトキシエトキシ)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-{2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ}ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(イソブチルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(2-メチルチアゾール-4-イル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(3,4-ジヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-{4-[2-(4-クロロフェニル)-5-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)ベンジルオキシ]フェニル}-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ピペリジノカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4, 4-ジメチル-2-オキサゾリン-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(2-ヒドロキシエチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- {(4-ピリジルメチル) カルバモイル} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -4- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (2-アミノチアゾール-4-イル) -2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルスルホニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベン

ゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (4-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (ジメチルカルバモイル) -2- (3-フルオロフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (5-クロロチオフエン-2-イル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2-ブromo-5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2-ブromo-5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (5-メチルオキサゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (5-メチルチアゾール-2-イル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5-テトラゾール-5-イルベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-シアノフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5-クロロ-2- (4-テトラゾール-5-イルフェニル) ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボ

ン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {2- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) エトキシ} ベンジルオキシ] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピペリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [3- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-ヒドロキシアミジノ) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソ-3H-1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2, 5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (シクロプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (シクロブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダ

ゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (tert-ブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソブチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(1-ヒドロキシプロパン-2-イル) カルバモイル} ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (メトキシカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- {(2, 3-ジヒドロキシプロピル) カルバモイル} ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-エチル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-メチル-N-プロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2, 6-ジメチルピペリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [5- (ブチルカルバモイル) -2- (4-クロロフェニル) ベン

ジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (プロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (エチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(ジメチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(モルホリノカルボニル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- ウレイドベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(エチルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- {(イソプロピルカルバモイル) アミノ} ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3, 4-ジフルオロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [2- (2, 4-ジフルオロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3, 5-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3-クロロ-4-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (3, 4-ジクロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-2-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- {4- (メチルチオ) フェニル} -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [4-クロロ-2- (4-クロロフェニル) -5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル}

—1—シクロヘキシルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[4—クロロ—2—(4—クロロフェニル)—5—(2—オキソピロリジン—1—イル) ベンジルオキシ]—2—フルオロフェニル}—1—シクロヘキシルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(イソプロピルアミノスルホニル) ベンジルオキシ]—2—フルオロフェニル}—1—シクロヘキシルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ]—2—フルオロフェニル}—1—シクロペンチルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(4—ヒドロキシピペリジン—1—イルカルボニル) ベンジルオキシ]—2—フルオロフェニル}—1—シクロペンチルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ]—2—フルオロフェニル}—1—シクロペンチルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル}—1—シクロペンチルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル}—1—シクロペンチルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(4—ヒドロキシピペリジン—1—イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル}—1—シクロペンチルベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル}—1—(テトラヒドロチオピラン—4—イル) ベンゾイミダゾール—5—カルボン酸 塩酸塩、

2—{4—[2—(4—クロロフェニル)—5—(ピロリジン—1—イルカル



ボニル) ベンジルオキシ] フェニル} - 1 - (テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - (テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - (テトラヒドロチオピラン-4-イル) ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - ピペリジノベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - ピペリジノベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (2-イミダゾリン-2-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (2-オキソオキサゾリジン-3-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (2-オキソイミダゾリジン-1-イル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2 - {4 - [2 - (4-クロロフェニル) - 5 - (2-オキサゾリン-2-イルアミノ) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2 - {4 - [{2 - [(ジメチルカルバモイル) メトキシ] メチル} - 4 - (4-フルオロフェニル) チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} - 1 - シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル) チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 二塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- [(カルバモイルメトキシ) メチル] チアゾール-5-イル} メトキシ] フェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- (メチルカルバモイル) チアゾール-5-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{4- (4-フルオロフェニル) - 2- {(2-ヒドロキシエチル) カルバモイル} チアゾール-5-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) チオフェン-3-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) チオフェン-3-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{2- (4-フルオロフェニル) - 5- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルカルボニル) チオフェン-3-イル} メトキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール、

2- {4- [2- (4-カルボキシフェニル) - 5-クロロベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシル-5-テトラゾール-5-イルベンゾイミダゾール 塩酸塩、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) - 5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] - 2-フルオロフェニル} - 1-シクロヘキシル-5- (2,

5-ジヒドロ-5-オキソ-4H-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) ベンゾイミダゾール 塩酸塩、

2- {4- [5-カルボキシ-2- (4-クロロフェニル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ジメチルカルバモイル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -5-シアノ-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール、

2- {4- [{N- (4-ジメチルカルバモイル) -N- (4-フルオロフェニル) アミノ} メチル] フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {5- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] -2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {3- [ビス (3-フルオロフェニル) メチル] -2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- {4- [(3-ジメチルカルバモイルフェニル) (4-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- {4- [{3- (4-ヒドロキシピペリジル-1-イルカルボニル) フェニル} (4-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

1- {[2- {4- ([4- (4-フルオロフェニル) -2-メチルチアゾール-5-イル] メトキシ) フェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} -β-D-グルクロン酸、

{[2- {4- [ビス (3-フルオロフェニル) メトキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} -β-D-グルクロン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (1, 1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロ

ヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

3- {[4-(5-アミノスルホニル-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-2-イル)-3-フルオロフェノキシ]メチル}-4-(4-クロロフェニル)-N-イソプロピルベンズアミド、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-6-(イソプロピルアミノカルボニル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-4-フルオロ-5-(1,1-ジオキソイソチアゾリジン-2-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルアミノカルボニル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシル-4-メトキシベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-イソプロピルカルボニル-N-メチルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(イソプロピルカルボニルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[3-{[4-(4-フルオロフェニル)-2-メチルチアゾール-5-イル]メチル}-4-ヒドロキシフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-4-フルオロ-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(メチルスルホニルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-メチル-N-(メチル

スルホニル) アミノ] ベンジルオキシ} - 2-フルオロフェニル] - 1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{[3-(4-クロロフェニル)-6-(2-オキソピロリジン-1-イル)ピリジン-2-イル]メチルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(アセチルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-エチルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-プロピルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-エチル-N-(メチルスルホニル)アミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-(メチルスルホニル)-N-プロピルアミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-(N-アセチル-N-メチルアミノ)ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-(エチルスルホニル)-N-メチルアミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2-[4-{2-(4-クロロフェニル)-5-[N-エチル-N-(エチルスルホニル)アミノ]ベンジルオキシ}-2-フルオロフェニル]-1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- [N- (エチルカルボニル) -N-メチルアミノ] ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- [N-エチル-N- (エチルカルボニル) アミノ] ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5-メトキシベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸、

2- [4- {2- (4-クロロフェニル) -5- (N-アセチル-N-イソプロピルアミノ) ベンジルオキシ} -2-フルオロフェニル] -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-カルボン酸 塩酸塩、

{[2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (2-オキソピロリジン-1-イル) ベンジルオキシ] -2-フルオロフェニル} -1-シクロヘキシルベンゾイミダゾール-5-イル] カルボニル} - $\beta$ -D-グルクロン酸、

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (イソプロピルカルバモイル) ベンジルオキシ] フェニル} -3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩、及び

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) -5- (ピロリジン-1-イルカルボニル) ベンジルオキシ] フェニル} -3-シクロヘキシル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-6-カルボン酸 塩酸塩からなる群より選ばれる請求項61記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩。

63. 請求項29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る医薬組成物。

64. 請求項1乃至28又は29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成るC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤。

65. 請求項1乃至28又は29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成る抗C型肝炎

ウイルス剤。

66. 請求項29乃至62のいずれかに記載の縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含んで成るC型肝炎治療剤。

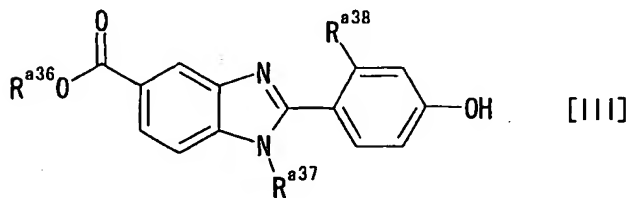
67. (a) 請求項65に記載の抗C型肝炎ウイルス剤と、(b) 他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤とを組み合わせる抗C型肝炎ウイルス剤。

68. (a) 請求項65に記載の抗C型肝炎ウイルス剤と、(b) インターフェロンとを組み合わせる抗C型肝炎ウイルス剤。

69. (a) 請求項64に記載のC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤と、(b) 他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤とを組み合わせるC型肝炎治療剤。

70. (a) 請求項64に記載のC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤と、(b) インターフェロンとを組み合わせるC型肝炎治療剤。

71. 下記一般式 [III] で表されるベンゾイミダゾール化合物又はその塩。



(式中、 $R^{a36}$  は水素原子又はカルボン酸保護基であり、 $R^{a37}$  はシクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、 $R^{a38}$  は水素原子又はフッ素原子である。)

72. 4-(4-フルオロフェニル)-5-ヒドロキシメチル-2-メチルチアゾール及び4-(4-フルオロフェニル)-5-クロロメチル-2-メチルチアゾールからなる群より選ばれるチアゾール化合物又は製薬上許容されるその塩。

73. 1-(4'-クロロ-2-ヒドロキシメチル-ビフェニル-4-イル)-2-ピロリジノン及び1-(4'-クロロ-2-クロロメチル-ビフェニル-4-イル)-2-ピロリジノンからなる群より選ばれるビフェニル化合物又は製薬上許容されるその塩。

74. (a) 請求項1記載の一般式 [I] で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び (b) 請求項1記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎

症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を含有する医薬組成物。

75. (a) 請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び(b) インターフェロンを含有する医薬組成物。

76. 有効量の請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎の治療方法。

77. 有効量の、請求項1記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を投与することをさらに含む、請求項76記載の方法。

78. 有効量のインターフェロン投与することをさらに含む、請求項76記載の方法。

79. 有効量の請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩を投与することを含む、C型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害方法。

80. 有効量の、請求項1記載の化合物以外の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも1つの薬剤を投与することをさらに含む、請求項79記載の方法。

81. 有効量のインターフェロン投与することをさらに含む、請求項79記載の方法。

82. C型肝炎治療用医薬を製造するための請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。

83. C型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害剤を製造するための請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩の使用。

84. 請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎治療用医薬組成物。

85. 請求項1記載の一般式〔I〕で表される縮合環化合物又は製薬上許容されるその塩、及び製薬上許容される担体を含有するC型肝炎ウイルスポリメラーゼ阻害用医薬組成物。

86. 請求項84記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎の治療用途



に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

87. 請求項85記載の医薬組成物、及び該医薬組成物をC型肝炎ウイルスポリメラーゼの阻害用途に使用することができる、または使用すべきであることを記載した該医薬組成物に関する記載物を含む商業パッケージ。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06405

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> A61K31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 31/427, 31/506, 31/437, C07D235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P31/12, 1/16, 43/00  
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> A61K31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 31/427, 31/506, 31/437, C07D235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P31/12, 1/16, 43/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1940-1992 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-1996  
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-1992 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2002

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y A	JP 06-025182 A (Kanebo, Ltd.), 01 February, 1994 (01.02.94), (Family: none)	86, 87 74, 75 1-73, 82-85
X Y A	EP 507650 A1 (Synthelabo S.A.), 07 October, 1992 (07.10.92), & JP 05-112563 A2 & US 5280030 A	86, 87 74, 75 1-73, 82-85
X Y A	EP 10063 A2 (Ciba-Geigy A.-G.), 16 April, 1980 (16.04.80), & JP 55-049374 A	86, 87 74, 75 1-73, 82-85
X Y A	Kataev, V.A. et al., Preparation and immunomodulating effect of (1-thietanyl-3)benzimidazoles., Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal, Vol.30, No.7 (1996), pages 22 to 24	86, 87 74, 75 1-73, 82-85

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&amp;" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
02 September, 2002 (02.09.02)

Date of mailing of the international search report  
17 September, 2002 (17.09.02)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06405

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 99/24060 A1 (Mayo Foundation for Medical Education and Research), 20 May, 1999 (20.05.99), & EP 1028745 A & JP 2001-522811 A	74, 75
Y	WO 97/41884 A1 (Pharma Pacific PTY. Ltd.), 13 November, 1997 (13.11.97), & EP 906119 A & US 5997858 A & JP 12-505478 A	74, 75
P, X	WO 01/47883 A1 (Japan Tobacco Inc.), 05 July, 2001 (05.07.01), & EP 1162196 A1 & JP 2001-247550 A	1-75, 82-87
P, X	WO 02/04425 A2 (Boehringer Ingelheim Ltd.), 17 January, 2002 (17.01.02), & US 2002065418 A	1-75, 82-87
A	WO 96/07646 A1 (Wellcome Foundation Ltd.), 14 March, 1996 (14.03.96), & US 5534535 A & EP 779885 A1 & JP 10-505092 A	1-75, 82-87
A	WO 97/25316 A1 (Glaxo Group Ltd.) 17 July, 1997 (17.07.97), & EP 886635 A1 & JP 2000-503017 A & US 5998398 A	1-75, 82-87

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06405

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 76-81

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Claims 76 to 81 pertain to methods for treatment of the human body by therapy and thus relate to a subject matter which this International Searching Authority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a)(i) of the PCT and Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT, to search.

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

Since the invention as set forth in claim 71 and the inventions as set forth in claims 72 and 73 relate to intermediates in different parts of the invention as set forth in claim 29, these inventions are not regarded as having a common technical feature.

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.

3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06405

Claims 1 to 5, 11 to 28, 74, 75 and 82 to 87 involve a great number of compounds in the scopes thereof. However, only parts of the claimed compounds are supported by the description in the meaning as defined in PCT Article 6 and disclosed therein in the meaning as defined in PCT Article 5.

Such being the case, this search has been made on the parts supported by the description and disclosed therein, i.e., the compounds as set forth in claims 6 to 10 and 29 to 73.

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> A61K31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 31/427, 31/506, 31/437, C07D235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P31/12, 1/16, 43/00

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> A61K31/4184, 31/4439, 31/42, 31/4523, 31/496, 31/55, 31/427, 31/506, 31/437, C07D235/18, 235/30, 409/12, 401/12, 413/12, 401/04, 403/12, 417/12, 405/12, 471/04, A61P31/12, 1/16, 43/00

## 最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報 1940-1992年  
 日本国公開実用新案公報 1971-1992年  
 日本国登録実用新案公報 1994-1996年  
 日本国実用新案登録公報 1996-2002年

## 国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN)、REGISTRY (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y A	JP 06-025182 A(鐘紡株式会社)1994.02.01 (ファミリーなし)	86, 87 74, 75 1-73, 82-85
X Y A	EP 507650 A1(Synthelabo S. A.)1992.10.07 & JP 05-112563 A2 & US 5280030 A	86, 87 74, 75 1-73, 82-85

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

02.09.02

国際調査報告の発送日

17.09.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

田村 聖子

4C

9051

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y A	EP 10063 A2(Ciba-Geigy A.-G.)1980.04.16 & JP 55-049374 A	86, 87 74, 75 1-73, 82-85
X Y A	Kataev, V. A. et. al., Preparation and immunomodulating effect of (1-thietanyl-3)benzimidazoles., Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal, Vol.30, No.7(1996)P.22-24	86, 87 74, 75 1-73, 82-85
Y	WO 99/24060 A1(MAYO FOUNDATION for MEDICAL EDUCATION and RESEARCH)1999.05.20 & EP 1028745 A & JP 2001-522811 A	74, 75
Y	WO 97/41884 A1(PHARMA PACIFIC PTY. LTD.)1997.11.13 & EP 906119 A & US 5997858 A & JP 12-505478 A	74, 75
PX	WO 01/47883 A1(Japan Tobacco Inc.)2001.07.05 & EP 1162196 A1 & JP 2001-247550 A	1-75, 82-87
PX	WO 02/04425 A2(Boehringer Ingelheim Ltd.)2002.01.17 & US 2002065418 A	1-75, 82-87
A	WO 96/07646 A1(Wellcome Foundation Limited)1996.03.14 & US 5534535 A & EP 779885 A1 & JP 10-505092 A	1-75, 82-87
A	WO 97/25316 A1(Glaxo Group Ltd.)1997.07.17 & EP 886635 A1 & JP 2000-503017 A & US 5998398 A	1-75, 82-87

第Ⅰ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 76-81 は、この国際調査機関が調査することを要しない対象に係るものである。つまり、  
請求の範囲76～81は、治療による人体の処置方法に関するものであって、PCT  
第17条(2)(a)(i)及びPCT規則39.1(iV)の規定により、この国際  
調査機関が国際調査を行うことを要しない対象に係るものである。
2. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしてい  
ない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に  
従って記載されていない。

第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1 ページの3 の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとその国際調査機関は認めた。

請求の範囲 7 1 に記載の発明と、請求の範囲 7 2 及び 7 3 に記載の発明は、請求の範囲 2 9 に記載の発明の異なる部分の中間体にかかるものであるから、両者は、技術的特徴を共有するものとは認められない。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☒ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみにについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。



請求の範囲1～5、11～28、74、75、82～87は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎない。

よって、調査は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、請求の範囲6～10、29～73に記載された化合物に関して行った。